日 FKU

JAPANESE GOVERNMENT

	-1	4.08.0	C
REC'D 25	AUG	2000	
WIPO		PCT	

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されて いる事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日

Date of Application:

2000年 3月22日

出

Application Number:

特願2000-080991

出 人 Applicant (s):

日本農薬株式会社

PRIORITY DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2000年 6月29日

特許庁長官 Commissioner, Patent Office

【書類名】 特許願

【整理番号】 C8101

【提出日】 平成12年 3月22日

【あて先】 特許庁長官 殿

【国際特許分類】 C07C233/64

A01N 37/18

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府泉南郡熊取町山の手台2丁目1番8号

【氏名】 町谷 幸三

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市西之山町1-28-202

【氏名】 遠藤 和義

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市原町270

【氏名】 中尾 勇美

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府羽曳野市誉田7丁目756番地の2

【氏名】 河野 栄司

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府堺市北野田296-1

【氏名】 遠西 正範

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市本多町5-6-301

【氏名】 坂田 和之

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市西之山町1-28-305

【氏名】 森本 雅之

【発明者】

【住所又は居所】 和歌山県橋本市紀見ケ丘2丁目3番19号

【氏名】

瀬尾 明

【特許出願人】

【識別番号】

000232623

【氏名又は名称】 日本農薬株式会社

【代理人】

【識別番号】 100068618

【弁理士】

【氏名又は名称】

夢 経夫

【電話番号】

03-3291-9721

【選任した代理人】

【識別番号】 100093193

【弁理士】

【氏名又は名称】 中村 壽夫

【選任した代理人】

【識別番号】 100104145

【弁理士】

【氏名又は名称】 宮崎 嘉夫

【先の出願に基づく優先権主張】

【出願番号】

平成11年特許願第190746号

【出願日】

平成11年 7月 5日

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 018120

【納付金額】

21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】

明細書 1

【物件名】

要約書

【包括委任状番号】 9710369

要

【プルーフの要否】

【書類名】 明細書

【発明の名称】 フタル酸ジアミド誘導体、その製造中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式(I):

【化1】

 ${\{}$ 式中、 ${\it R}^1$ 、 ${\it R}^2$ 及び ${\it R}^3$ は同一又は異なっても良く、水素原子、 ${\it C}_3$ - ${\it C}_6$ シク ロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基又は $-A^1$ -(G) r(式中、 A^1 は C_1 - C_8 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基又は C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 Gは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基 、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルコキシ ホスホリル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルコキシチオホスホリル基、 ジフェニルホスフィノ基、ジフェニルホスホノ基、フェニル基、同一又は異なっ ても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 ア ルコキシ基、ハロ $c_1^{-c_6}$ アルコキシ基、 $c_1^{-c_6}$ アルキルチオ基、ハロ $c_1^{-c_6}$ アル キルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル 基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択さ れる1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(複素環基とはピリジル 基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリ ル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、オキサ ゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾ リル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基又はピラゾリル基

を示す。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ

 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アル キルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アル キルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ 。)又は- ${ t Z}^3$ – ${ t R}^4$ (式中、 ${ t Z}^3$ は-O-、-S-、-SO-、-SO $_2$ -又は -N $(R^5$) - (式中、 R^5 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C $_1^{-C_6}$ アルキルカルボニル基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニ ル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 $c_1^{-c_6}$ アルコキシ基、ハロ $c_1^{-c_6}$ アルコキシ基、 $c_1^{-c_6}$ アルキルチ オ基、ハロ c_1 - c_6 アルキルチオ基、 c_1 - c_6 アルキルスルフィニル基、ハロ c_1 - c_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 $-C_6$ アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキル スルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基 、フェニル C_1 - C_Δ アルコキシカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハ ロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上 の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルコキシカルボニル基を示す。) を示し、 R^4 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 ア ルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキ ニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルキ ルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニ ル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 $-C_6$ アルキル基 、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基 、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 1-C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル 基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコ

出証特2000-3053716

キシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル $C_1^{-C_6}$ アルキル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)を示す。)を示す。 1 は 1 なび 1 を示す。)を示す。 1 なび 1 なが 1 なび 1 なび 1 なび 1 なび 1 なび 1 なび 1 なが 1 なが 1 なび 1 なび 1 なび 1 なが 1 なび 1 なび 1 なび 1 なび 1 なび 1 なが 1 な

Xは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基 、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル基、同一又 は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 $_1$ - $_{C_6}$ アルキルチオ基、 $_{C_1}$ - $_{C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $_{C_1}$ - $_{C_6}$ アルキルスル フィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基 から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ 。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチ オ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキル スルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。) 又は $-A^2-R^6$ (式中、 A^2 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ - 、-C (=O) -、-C(=NOR 7)-(式中、 7 は水素原子、 7 は水素原子、 7 にないまいま、ハ ロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 ア ルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基又は同一若し くは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基

- 、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基外ら選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基を示す。)、 C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基を示し、
- (1) A^2 が-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2$ -を示す場合、 R^6 はハロ C $_3^{-C}_6$ シクロアルキル基、ハロ $_{C_3^{-C}_6}$ シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は 異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $_1^{-C_6}$ C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基、ハロ C₁-C₆ア ルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルス ルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)又 は $-A^3-R^8$ (式中、 A^3 は C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1-C_6 アルキレン基、 C_1 $_3^{-C_6}$ アルケニレン基、ハロ $_{3}^{-C_6}$ アルケニレン基、 $_{3}^{-C_6}$ アルキニレン基又はハ ロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 R^8 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロ アルキル基、ハロ $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシカルボニル基、フ ェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキル基、 $_{C_1}^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_{C_1}^{-C_6}$ アルコキシ基、 $_{C_1}^{-C_6}$ アルキ ルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $_{1}^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $_{1}^{-C_6}$ アル キルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基又は-

 A^4-R^9 (式中、 A^4 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -又は-C (=O

(2) A^2 が-C (=O) -又は-C (=NOR 7)- (式中、 R^7 は前記に同じ。

アミノ基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲ

ン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)を示し、

(3) A^2 が C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン 基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニ レン基を示す場合、 R^6 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、フェニル基、同 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル 基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル スルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に 同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキル基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルコキシ基、ハロ $_{C_1^{-C_6}}$ アルコキシ基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルキ ルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $_{1}^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $_{1}^{-C_6}$ アル キルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ 。) 又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 は-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2$ -を 示し、 R^{10} は C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキル基、 $c_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $c_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $c_1^{-C_6}$ アルキルチオ 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルス ルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、

ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 -C6アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記 に同じ。)又は $-A^6-R^{11}$ (式中、 A^6 は C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1-C_6 アル キレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニ レン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 R^{11} は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は 異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 $-C_6$ アルキル基、ハロ C_1 $-C_6$ アルキル基、 C_1 $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $_1^{-C_6}$ C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は 異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 $_1$ - $_6$ アルコキシ基、ハロ $_1$ - $_6$ アルコキシ基、 $_1$ - $_6$ アルキルチオ基、ハロ $_1$ - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基 、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス

、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基 、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基 、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル

ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル

基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基(前記

に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C₁-C₆アルキル基

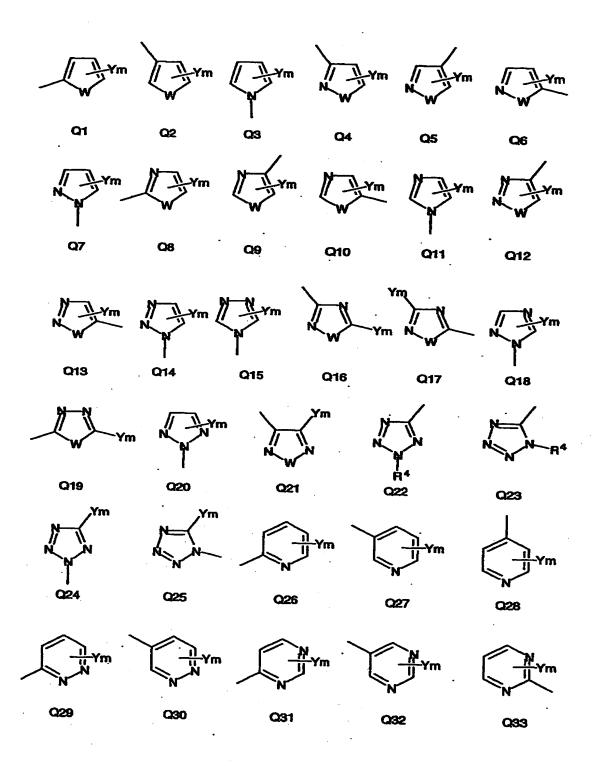
 $_1$ - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前

記に同じ。)を示す。)を示す。)を示す。)を示す。

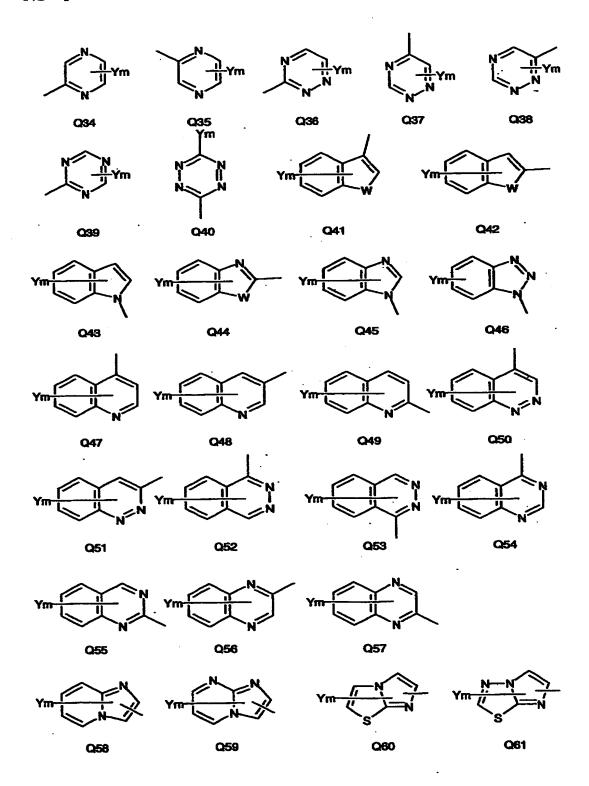
nは1~4の整数を示す。又、Xはフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒 になって縮合環(縮合環とはナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、 インダン、キノリン、キナゾリン、クロマン、イソクロマン、インドール、イン ドリン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベン ゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンゾオキサゾール 、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール又はインダゾールを示す。)を形成す ることができ、該縮合環は、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 ア ルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ 基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロ ゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $_1^{-C_6}$ アル キルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の 置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異 なっても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィ ニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から 選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)から選択される1 以上の置換基を有することもできる。

QはQ $1\sim$ Q61からなる置換されても良いN, S, Oを含む複素環又は置換されても良い縮合複素環を表し、

【化2】



【化3】



(式中、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニ

トロ基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、

ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、 複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカニル基又はハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)又は $-A^2$ - R^6 (式中、 A^2 及び R^6 は前記に同じ。)を示し、mは $1\sim6$ の整数を示す。

又、Yは環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環(前記に同じ。)を 形成することができ、該縮合環は、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C $_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルキル基、 $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_1^{-C_6}$ アル コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキル スルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く 、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ 基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ 基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若し くは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基 、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)から選択さ れる1以上の置換基を有することもできる。

WはO、S、N-R 12 (式中、R 12 は水素原子、 12 C₁-C₆アルキル基、ハロ 12 C₁-

 C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニ ル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロア ルキル基、 c_1 - c_6 アルコキシ c_1 - c_6 アルキル基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ c_1 - c_6 ア ルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 $-C_6$ アルキルスルフィニル C_1 $-C_6$ アルキル基、ハロ C_1 $-C_6$ アル キルスルフィニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルカルボニル基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基 、 c_1 - c_6 アルコキシ基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 c_1 - c_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C_1 - C_{Δ} アル キル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキ ルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C₁-C₁アルキル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子 、 $c_1^{-c}c_6$ アルキル基、ハロ $c_1^{-c}c_6$ アルキル基、 $c_1^{-c}c_6$ アルコキシ基、ハロ $c_1^{-c}c_6$ アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アル キルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル ホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換フェニルカルボニル基を示す。R4 は前記に同じ。)を示す。 Z^{1} 及び Z^{2} は酸素原子又は硫黄原子を示す。

但し、X、 R^1 及び R^3 が同時に水素原子を示し、 Z^1 及び Z^2 が同時に酸素原子を示し、かつQがQ27を示し、Yが2位塩素原子である場合、 R^2 が1,

2, 2- トリメチルプロピル基を除く。}

で表されるフタル酸ジアミド誘導体。

【請求項2】 一般式(IV'):

【化4】

$$Q'-NH_2$$
 (IV')

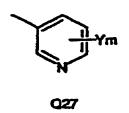
(式中、Q'が (1) Q26、Q28~Q34及びQ36~Q40 【化5】

を表す場合、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基を示し、mは1~4の整数を示し、且つYm

のうち、少なくとも1つはパーフルオロ C_2 - C_6 アルキル基を示し、

(2) Q' がQ27

【化6】



を示す場合、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基を示し、 C_1 - C_6 アルコキシ基又はハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基を示す。)

で表される複素環アミン誘導体。

【請求項3】 一般式(I):

【化7】

$$Xn = \begin{bmatrix} Z^1 \\ N(R^1)R^2 \\ N(R^3)Q \end{bmatrix}$$
 (I)

ホスホリル基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆アルコキシチオホスホリル基、 ジフェニルホスフィノ基、ジフェニルホスホノ基、フェニル基、同一又は異なっ ても良く、ハロゲン原子、 $c_1^{-c_6}$ アルキル基、ハロ $c_1^{-c_6}$ アルキル基、 $c_1^{-c_6}$ ア ルコキシ基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 c_1 - c_6 アルキルチオ基、ハロ c_1 - c_6 アル キルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル 基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択 される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(複素環基とはピリジ ル基、ピリジンーNーオキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフ リル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、オキ サゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチア ゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基又はピラゾリル 基を示す。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 ア ルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同 じ。) 又は $-Z^3-R^4$ (式中、 Z^3 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ - 又 は $-N(R^5)$ - (式中、 R^5 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、フェニルカルボ ニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキ ルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル 基、フェニル C_1 - C_4 アルコキシカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、 ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基 、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 c_1 - c_6 アルキルチオ基、ハロ c_1 - c_6 アルキルチオ基 、 c_1^{-C} $_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ c_1^{-C} $_6$ アルキルスルフィニル基、 c_1^{-C} $_6$ アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以

上の置換基を環上に有する置換フェニル C₁-C₄アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、 R^4 は水素原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_3^{-C_6}$ アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アル キニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アル キルカルボニル基、ハロ $C_1^{-C}_6$ アルキルカルボニル基、 $C_1^{-C}_6$ アルコキシカルボ ニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル 基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_1 - c_6 アルコキシ基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 c_1 $_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $_{C_1}^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $_{C_1}^{-C_6}$ アルキルスルフィニル 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニ ル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C $_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルキル基、 $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_1^{-C_6}$ アル コキシ基、 c_1 - c_6 アルキルチオ基、ハロ c_1 - c_6 アルキルチオ基、 c_1 - c_6 アルキル スルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上 に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若 しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 c_1 - c_6 アルキル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル スルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)を示す。)を示す。rは1〜4の整数を示す。)を示す。又、 ${ t R}^1$ 及び ${ t R}^2$ は互いに結合 して1~3個の同一又は異なっても良く、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子によ り中断されても良い4~7員環を形成することもできる。

Xは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、ハロ $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスル

フィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基 から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ 。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $\mathrm{C_1^{-C}_6}$ アルキル基、ハロ $\mathrm{C_1^{-C}_6}$ アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチ オ基、ハロ c_1 - c_6 アルキルチオ基、 c_1 - c_6 アルキルスルフィニル基、ハロ c_1 - c_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキル スルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。) 又は $-A^2-R^6$ (式中、 A^2 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2-$ 、-C (= O) -、- C ($= NOR^7$)-(式中、 R^7 は水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 ア ルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基又は同一若し くは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基 、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基 を示す。)、 c_1 - c_6 アルキレン基、ハロ c_1 - c_6 アルキレン基、 c_2 - c_6 アルケニレ ン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキ ニレン基を示し、



ルキルスルフィニル基、 c_1 - c_6 アルキルスルホニル基又はハロ c_1 - c_6 アルキルス ルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)又 は $-A^3-R^8$ (式中、 A^3 は C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1-C_6 アルキレン基、 C_1 $_3^{-C_6}$ アルケニレン基、ハロ $_{C_3}^{-C_6}$ アルケニレン基、 $_{C_3}^{-C_6}$ アルキニレン基又はハ ロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 R^8 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロ アルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、フ ェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 $_1$ - $_{6}$ アルキル基、 $_{1}$ - $_{6}$ アルコキシ基、ハロ $_{1}$ - $_{6}$ アルコキシ基、 $_{1}$ - $_{6}$ アルキ ルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 $_1$ - $_6$ アルキルスルフィニル基、 $_1$ - $_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $_1$ - $_6$ アル キルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基又は- A^4 -R⁹ (式中、 A^4 は-O-、-S-、-SO-、-SO₂ -又は-C (=O) ーを示し、 R^9 は C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニ ル基、ハロ c_3 - c_6 アルケニル基、 c_3 - c_6 シクロアルキル基、ハロ c_3 - c_6 シクロア ルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 $-C_6$ P ルキ ル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_1 - c_6 アルコキシ基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハ ロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェ ニル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン 原子、 c_1 - c_6 アルキル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_1 - c_6 アルコキシ基、ハロ c_1 $_1$ - $_6$ アルコキシ基、 $_1$ - $_6$ アルキルチオ基、ハロ $_1$ - $_6$ アルキルチオ基、 $_1$ - $_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキル スルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換 基を有する複素環基(前記に同じ。)を示す。)を示す。)を示し、

(2) A^2 が-C (=O) -又は-C ($=NOR^7$)- (式中、 R^7 は前記に同じ。) を示す場合、 R^6 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6

 $_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルコキシ基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルキルチオ基、モノ $_{C_1^{-C_6}}$

 C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フェ ニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 ${
m C_1-C_6}$ アルキル基、ハロ ${
m C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}-C_{1}$ C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキ ルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニ ルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アル キルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル アミノ基、複素環基(前記に同じ。) 又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲ ン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキ ルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置 換基を有する複素環基(前記に同じ。)を示し、

(3) A^2 が $C_1^{-C_6}$ アルキレン基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキレン基、 $C_2^{-C_6}$ アルケニレン基、 $C_2^{-C_6}$ アルケニレン基、 $C_2^{-C_6}$ アルキニレン基又はハロ $C_3^{-C_6}$ アルキニレン基を示す場合、 R^6 は水素原子、ハロゲン原子、 $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、 ハロ $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオースルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基ンはハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基とはハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基から選択される $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオー $C_1^{-C_6}$ アルキオー $C_1^$

 $_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $_{C_1}^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $_{C_1}^{-C_6}$ アル キルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ 。) 又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 は-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2$ -を 示し、 R^{10} は C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル 基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルス ルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_1 - c_6 アルコキシ基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 c_1 - c_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 -Cgアルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記 に同じ。)又は $-A^6-R^{11}$ (式中、 A^6 は C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1-C_6 アル キレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニ レン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 R^{11} は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は 異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $_1^{-C_6}$ C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基か ら選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は 異なっても良く、ハロゲン原子、 c_1 - c_6 アルキル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_6 $_1$ - $_{\mathrm{C_6}}$ アルコキシ基、ハロ $_{\mathrm{C_1-C_6}}$ アルコキシ基、 $_{\mathrm{C_1-C_6}}$ アルキルチオ基、ハロ $_{\mathrm{C_1-C_6}}$ C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ

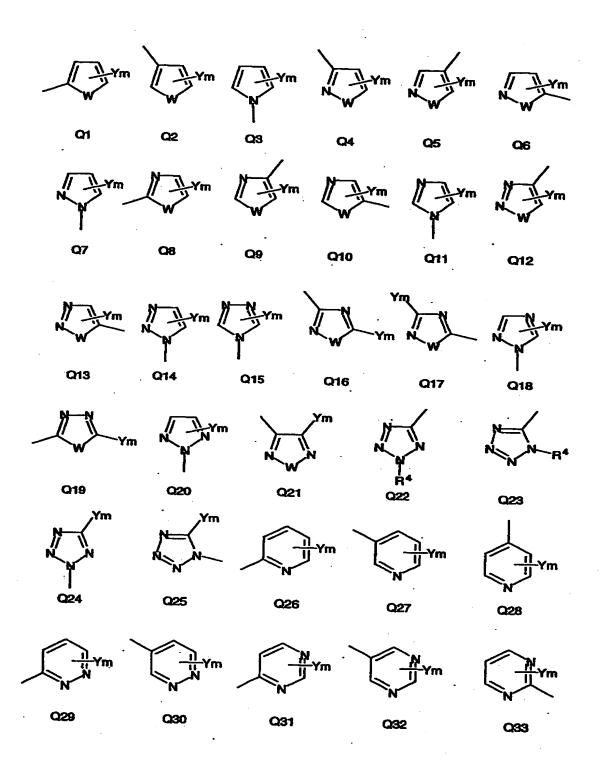
nは1~4の整数を示す。又、Xはフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒 になって縮合環(縮合環とはナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、 インダン、キノリン、キナゾリン、クロマン、イソクロマン、インドール、イン ドリン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベン ゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンゾオキサゾール 、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール又はインダゾールを示す。)を形成す ることができ、該縮合環は、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 ア ルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ 基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又 はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハ ロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロ $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上 の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは

出証特2000-3053716

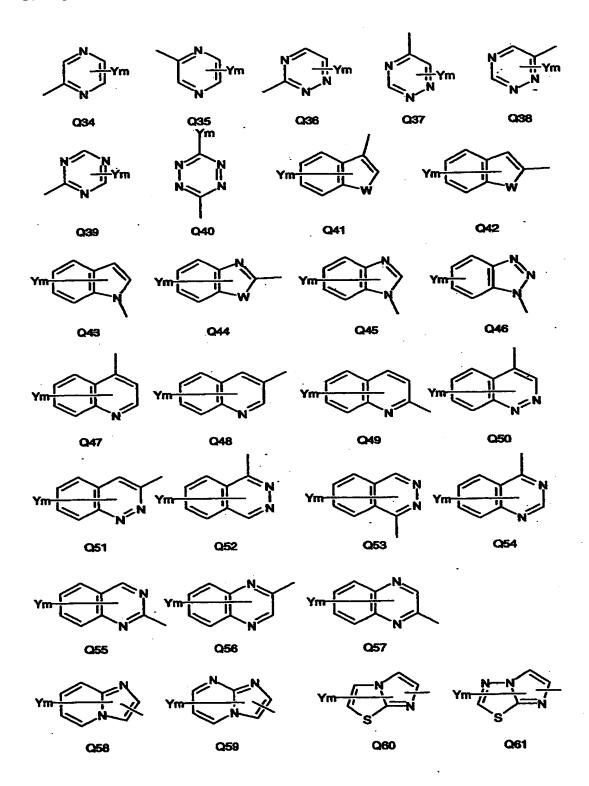
異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有するともできる。

QはQ $1\sim$ Q61からなる置換されても良いN, S, Oを含む複素環又は置換されても良い縮合複素環を表し、

【化8】



【化9】



(式中、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニ

トロ基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、

ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、 複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)又は - A^2 - A^2 A^2 A^2 A^2 A^3 A^3 A^4 A^4

又、Yは環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環(前記に同じ。)を 形成することができ、該縮合環は、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C $_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルキル基、 $_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $_1^{-C_6}$ アル コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキル スルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く 、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ 基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ 基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若し くは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基 、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル 基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)から選択さ れる1以上の置換基を有することもできる。

WはO、S、N-R 12 (式中、R 12 は水素原子、 12 Compute 12 Comput

 C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニ ル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロア ルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 ア ルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アル キルスルフィニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 $_1$ - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基 、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基から選択される 1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C_1 - C_{A} アル キル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキ ルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C₁- C_4 アルキル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子 、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アル キルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル ホニル基又はハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を 有する置換フェニルカルボニル基を示す。 R^4 は前記に同じ。)を示す。 Z^1 及び Z^2 は酸素原子又は硫黄原子を示す。 $\}$

で表されるフタル酸ジアミド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする 農園芸用薬剤。

【請求項4】 農園芸用薬剤が農園芸用殺虫剤である請求項3記載の農園芸

用薬剤。

【請求項5】 有用作物から害虫を防除するために請求項3又は4いずれか 1項記載の農園芸用薬剤の有効量を対象作物に処理することを特徴とする農園芸 用薬剤の使用方法。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】

本発明はフタル酸ジアミド誘導体、その製造中間体及び該化合物を有効成分と して含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するも のである。

[0002]

【従来の技術】

特開昭59-163353号公報、特開昭61-180753号公報及びジャーナル・オブ・ケミカルソサイアティー(J. C. S. Perkin I、1338-1350、(1978))等に本発明のフタル酸ジアミド誘導体の一部の化合物が開示されているが、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤として有用である記載及び示唆は全くされていない。又、該フタル酸ジアミド誘導体を製造するための中間体化合物である一般式(IV)で表される複素環アミン誘導体は文献未記載の新規化合物である。

[0003]

【発明が解決しようとする課題】

本発明者等は新規な農園芸用薬剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体は文献未記載の新規化合物であり、先行技術に開示の化合物も含めた農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤として新規な用途を見いだし、更に一般式(IV')で表される複素環アミン誘導体は文献未記載の新規化合物であり、該化合物は医薬、農薬等の生理活性を示す各種誘導体を製造する上で有用な中間体であることを見いだし、本発明を完成させたものである。

[0004]



本発明は一般式(I):

【化10】

$$Xn = \begin{bmatrix} Z^1 \\ N(R^1)R^2 \\ N(R^3)Q \end{bmatrix}$$
 (I)

{式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基又は A^1 -(G) r (式中、 A^1 は C_1 - C_8 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基又は C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、Gは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルコキシホスホリル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルコキシボスホリル基、ジフェニルホスフィノ基、ジフェニルホスホノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルメルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカイニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカイニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカイニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、

[0005]

複素環基(複素環基とはピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チェニル基、テトラヒドロチェニル基、テトラヒドロピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、インチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基又はピラゾリル基を示す。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキ

[0006]

 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択され る1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル C_1 $-C_4$ アルコキ シカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキ ル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_1 - c_6 アルコキシ基、ハロ c_1 - c_6 アルコキシ基、 C_1 $-C_6$ アルキルチオ基、ハロ C_1 $-C_6$ アルキルチオ基、 C_1 $-C_6$ アルキルスルフィニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハ ロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置 換フェニル C_1 - C_4 アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、 R^4 は水素原子、 c_1 - c_6 アルキル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 c_3 - c_6 アルケニル基、ハロ c_3 - c_6 ア ルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアル キル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 $_6$ アルキルカルボニル基、 $_{\mathrm{C_1}^{-\mathrm{C_6}}}$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又 は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $_1^{-C_6}$ アルキルスル フィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基 から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C_1 - C_Δ アルキ ル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、

[0007]

ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6

[0008]

Xは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基 、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル基、同一又 は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $_{1}^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $_{1}^{-C_6}$ アルキルスル フィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基 から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ 。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 c_1 - c_6 アルキル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチ オ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキル スルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。) 又は $-A^2-R^6$ (式中、 A^2 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -、-C (= O) -、-C ($= NOR^7$)- (式中、 R^7 は水素原子、 $C_1 - C_6$ アルキル基、ハ ロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 ア ルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル C_1 - C_4 アルキル基又は同一若し くは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、

[0009]

ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基を示す。)、 C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、スはハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、

(1) A^2 が-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2$ - を示す場合、 R^6 はハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ

[0010]

 ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^4$ - R^9 (式中、 A^4 は-O-、-S-、-SO-、 $-SO_2$ -又は-C(=O) -を示し、 R^9 は C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_3 - C_6 ウクロアルキル基、 C_3 - C_6 ウクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、

[0011]

(2) A^2 が-C (=O) -又は-C ($=NOR^7$)- (式中、 R^7 は前記に同じ。) を示す場合、 R^6 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、N $-C_1$ - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルカル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルメルフィニル基、チオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、

[0012]

<u>ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基</u>

、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコキシ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又はハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカロの置換基を有する複素環基(前記に同じ。)を示し、

[0013]

(3) A^2 が C_1 - C_6 アルキレン基、ハロ C_1 - C_6 アルキレン基、 C_2 - C_6 アルケニレン 基、ハロ C_2 - C_6 アルケニレン基、 C_2 - C_6 アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニ レン基を示す場合、 R^6 は水素原子、ハロゲン原子、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、フェニル基、同 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル 基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハ ロ c_1 - c_6 アルキルチオ基、 c_1 - c_6 アルキルスルフィニル基、ハロ c_1 - c_6 アルキル スルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニ ル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に 同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 $_1$ - $_C$ 6アルキル基、 $_C1$ - $_C$ 6アルコキシ基、ハロ $_C1$ - $_C$ 6アルコキシ基、 $_C1$ - $_C$ 6アルキ ルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ $_1$ - $_6$ アルキルスルフィニル基、 $_1$ - $_6$ アルキルスルホニル基又はハロ $_1$ - $_6$ アル キルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ 。) 又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 は-O-、-S-、-SO-又は $-SO_2$ - - -示し、 R^{10} は C_3 - C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、

[0014]

フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アル キルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複 素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アル キル基、ハロ c_1^{-c} アルキル基、 c_1^{-c} アルコキシ基、ハロ c_1^{-c} アルコキシ基 、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィ ニル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基又は ハロ C₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環 基(前記に同じ。)又は $-A^6-R^{11}$ (式中、 A^6 は C_1-C_6 アルキレン基、ハロ C_1 $_{1}^{-C_{6}}$ アルキレン基、 $_{2}^{-C_{6}}$ アルケニレン基、ハロ $_{2}^{-C_{6}}$ アルケニレン基、 $_{2}^{-C_{6}}$ アルキニレン基又はハロ C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 R^{11} は水素原子、ハロゲ ン原子、 $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、ハロ $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルコ キシ基、ハロ $c_1^{-c}_6$ アルコキシ基、 $c_1^{-c}_6$ アルキルチオ基、ハロ $c_1^{-c}_6$ アルキル チオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、

[0015]

フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオースルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、

ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、

[0016]

nは $1\sim 4$ の整数を示す。又、X はフェニル環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環(縮合環とはナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、クロマン、イソクロマン、インドール、インドリン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール又はインダゾールを示す。)を形成することができ、該縮合環は、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ロ C_1 - C_6 アルキルスルカスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、カロ C_1 - C_6 アルキル基、ストロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、

[0017]

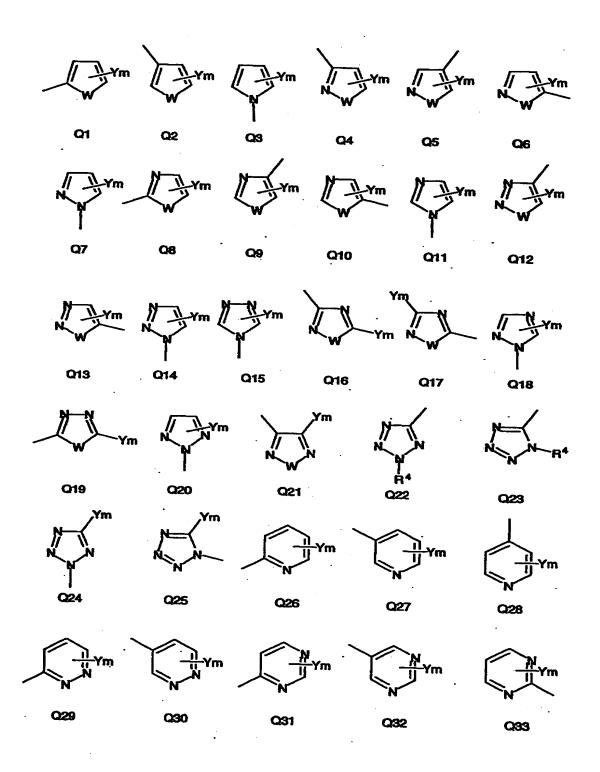
ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは

異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)から選択される1以上の置換基を有することもできる。

QはQ1 \sim Q61 χ 0 χ 0 からなる置換されても良い χ 0 χ 0 があるでは置換されても良い縮合複素環を表し、

[0018]

【化11】



[0019]

【化12】

[0020]

(式中、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ C_3 - C_6 シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、 複素環基(前記に同じ。)、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルメルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルメルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカンフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカンフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)又は - A^2 - A^2 - A^2 A^2 A^2 A^2 A^2 A^3 A^4 A^4

[0021]

又、Yは環上の隣り合った炭素原子と一緒になって縮合環(前記に同じ。)を形成することができ、該縮合環は、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカイニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカイニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカイニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルホニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカイニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ 基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルフィニル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカースールスルホニルを図換基を有する置換フェニル基、 複素環基(前記に同じ。)又は同一若しくは異なっても良く、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオースルカースルカースルカースルボニル基とは $C_1^{-C_6}$ アルキルスルカースルホニル

基から選択される1以上の置換基を有する複素環基(前記に同じ。)から選択される1以上の置換基を有することもできる。

[0022]

WはO、S、N-R 12 (式中、R 12 は水素原子、 $^{C_1-C_6}$ アルキル基、ハロ $^{C_1-C_6}$ C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニ ル基、ハロ $C_3^{-C_6}$ アルキニル基、 $C_3^{-C_6}$ シクロアルキル基、ハロ $C_3^{-C_6}$ シクロア ルキル基、 $c_1^{-c_6}$ アルコキシ $c_1^{-c_6}$ アルキル基、ハロ $c_1^{-c_6}$ アルコキシ $c_1^{-c_6}$ ア ルキル基、 $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ $C_1^{-C_6}$ アルキル基、ハロ $C_1^{-C_6}$ アルキルチオ $C_1^{-C_6}$ C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アル キルスルフィニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル 基、ハロ $_{1}^{-c}$ アルキルスルホニル $_{1}^{-c}$ アルキル基、 $_{1}^{-c}$ アルキルスルホニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、ハロ C_1 $_1^{-C_6}$ アルキルカルボニル基、 $_{C_1^{-C_6}}$ アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一 又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基 、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル C_1 - C_4 アル キル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、

[0023]

ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_4 アルキル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオールチオールチャー・ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の

置換基を有する置換フェニルカルボニル基を示す。 R^4 は前記に同じ。)を示す

 Z^1 及び Z^2 は酸素原子又は硫黄原子を示す。

但し、X、 R^1 及び R^3 が同時に水素原子を示し、 Z^1 及び Z^2 が同時に酸素原子を示し、かつQが Q^2 7を示し、Yが2位塩素原子である場合、 R^2 が1, 2, 2- トリメチルプロピル基を除く。}

で表されるフタル酸ジアミド誘導体及び農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤並び にその使用方法に関するものであり、更には該フタル酸ジアミド誘導体等を製造 するための中間体である一般式(IV'):

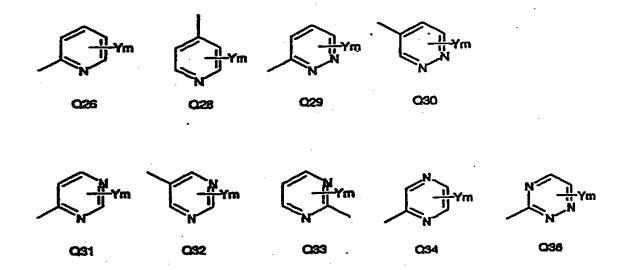
[0024]

【化13】

$$Q'-NH_9$$
 (IV')

(式中、

(1) Q'がQ26、Q28~Q34及びQ36~Q40【化14】



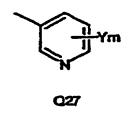
【化15】

[0025]

を示す場合、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基を示し、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルスルホニル

(2) Q' がQ27

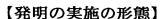
【化16】



を示す場合、Yは同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基を示し、 C_1 - C_6 アルコキン基又はハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基を示す。)

で表される複素環アミン誘導体に関するものである。

[0026]



本発明のフタル酸ジアミド誘導体の一般式(I)の定義において「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「 C_1 - C_6 アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチルを示す。n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチルメチル、n-ペンチル、n-ペンチルメチル、n-ペンチルメチル、n-ペンチルメチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチルメチル、n-ペンチルメチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペンチル、n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン・n-ペン

[0027]

「R¹ 及びR² はお互いに結合して1から3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い4~7員環」としては、例えばアゼチジン環、ピロリジン環、ピロリン環、ピペリジン環、イミダゾリジン環、イミダゾリン環、オキサゾリジン環、チアゾリジン環、イソキサゾリジン環、イソチアゾリジン環、テトラヒドロピリジン環、ピペラジン環、モルホリン環、チオモルホリン環、ジオキサジン環、ジチアジン環等を例示することができる

[0028]

本発明の一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体は、その構造式中に不 斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種の光学異性体が存在する場合も あり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも 全て包含するものである。又、場合によりこれらの化合物の塩、水和物等も含む ものである。

本発明化合物の製造に関しては、例えば次のスキーム1及び2に示す方法等で製造することができるが、本発明は、特願平10-350768号公報によって 示されている方法等でも製造できる。

[0029]

製造方法1

【化17】

$$X_{\Pi} = \begin{bmatrix} Z^{1} & CNH_{2}(N) & Z^{1} & R^{1}R^{2}NH(II) \\ Z^{2} & CNH_{2}(N) & Z^{2} & R^{1}R^{2}NH(II) \\ Z^{2} & CNH_{2}(N) & CNH_{2$$

(式中、 R^1 、 R^2 、 Z^1 、 Z^2 、X、Q、nは前記に同じ)

一般式(V) で表される無水フタル酸誘導体と一般式(IV)で表される複素環アミン誘導体とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(III) で表されるフタル酸イミド誘導体とし、該フタル酸イミド誘導体(III) を単離し又は単離せずして一般式(II)で表されアミン類と反応させることにより、一般式(I-1)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

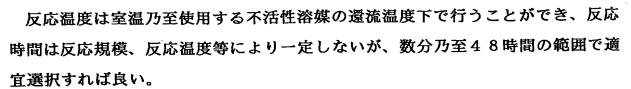
[0030]

(1). 一般式(V) →一般式(III)

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の塩素化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1,3ージメチルー2ーイミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

[0031]

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ かの反応剤を過剰に使用することもできる。本反応は必要に応じて脱水条件下で 反応を行うこともできる。



反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

[0032]

一般式(V) で表される無水フタル酸誘導体はJ. Org. Chem., <u>52</u>, 129 (1987)、J. Am. Chem. Soc., <u>51</u>, 1865 (1929)、同, <u>63</u>, 1542 (1941)等に記載の方法により製造することができ、一般式(IV)で表される複素環アミン誘導体はJ. Org. Chem., <u>18</u>, 138 (1953)、J. Org. Chem., <u>28</u>, 1877 (1963)、Chem. Ber., <u>89</u>, 2742 (1956)、Proc. Indian Acad. Sci., <u>37A</u>, 758, (1953)、J. Heterocy cl. Chem., <u>17</u>, 143, (1980)、特開昭62-96479号公報、特開平10-340345号公報及び特開平11-302233号公報等に記載の方法により製造することができる。

[0033]

(2). 一般式(III) →一般式(I-1)

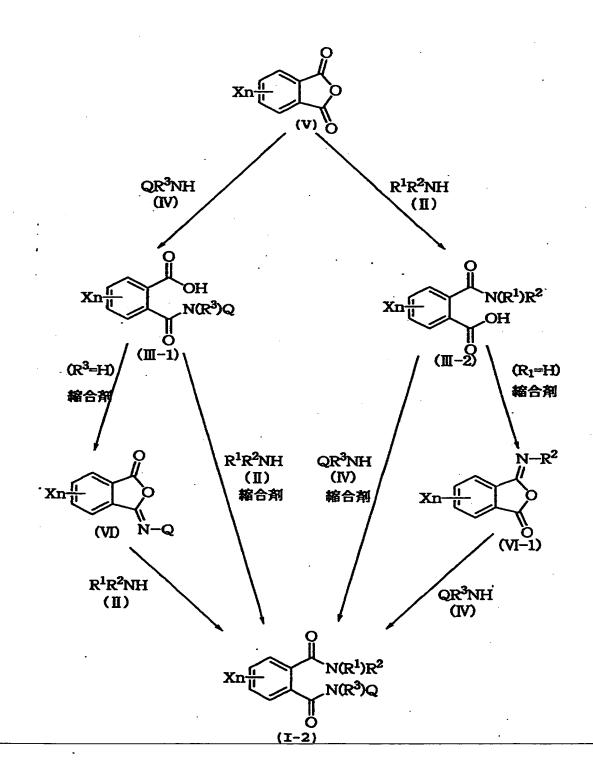
本反応で使用できる不活性溶媒は(1)で使用できる不活性溶媒を例示することができる。本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、一般式(II)で表されるアミン類を過剰に使用することもできる。反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応 じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造す ることができる。



製造方法2

【化18】



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Q及びnは前記に同じ) 【0035】

一般式(V) で表される無水フタル酸誘導体と一般式(II)で表されるアミン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(III-2) で表されるフタル酸アミド類とし、該フタル酸アミド類(III-2) を単離し又は単離せずして、R が水素原子を示すフタル酸アミド類(III-2) の場合、縮合剤の存在下に縮合反応を行い、一般式(VI-1)で表される化合物とし、該化合物(VI-1)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(IV)で表される複素環アミン誘導体と反応させ、フタル酸アミド類(III-2) のR が水素原子以外を示すフタル酸アミド類(III-2) の場合、一般式(IV)で表される複素環アミン類と縮合剤の存在下に縮合反応させることにより一般式(I-2) で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

[0036]

又は一般式(V)で表される無水フタル酸誘導体と一般式(IV)で表される複素環アミン誘導体とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(III-1)で表されるフタル酸アミド類とし、該フタル酸アミド類(III-1)を単離し又は単離せずして、R³が水素原子を示すフタル酸アミド類(III-1)の場合、縮合剤の存在下に縮合反応を行い、一般式(VI)で表される化合物とし、該化合物(VI)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(II)で表されるアミン類と反応させ、R³が水素原子以外のフタル酸アミド類(III-1)の場合、一般式(II)で表されるアミン類と縮合剤の存在下に縮合反応させることにより一般式(I-2)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

[0037]

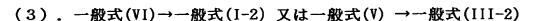
(1). 一般式(V) → 一般式(III-2) 又は一般式(VI-1)→ 一般式(I-2)

本反応は製造方法1-(2)と同様にすることにより目的物を製造することが できる。

(2). 一般式(III-1) → 一般式(VI)又は一般式(III-2) → 一般式(VI-1)

本反応はJ. Med. Chem., 10, 982 (1967) に記載の方法に

従って目的物を製造することができる。



本反応は製造方法1-(2)と同様にすることにより目的物を製造することができる。

[0038]

(4). 一般式(III-1) 又は一般式(III-2) →一般式(I-2)

一般式(III-1) 又は一般式(III-2) で表されるフタル酸アミド誘導体と、一般式(II)又は一般式(IV)で表されるアミン類を縮合剤及び不活性溶媒の存在下に反応させて製造することができる。本反応は、必要に応じて塩基の存在下に反応することもできる。

[0039]

本反応で使用する不活性溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、クロロホルム、塩化メチレン等を例示することができる。本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれば良く、例えば向山試薬(2ークロローNーメチルピリジニウム アイオダイド)、DCC(1,3ージシクロヘキシルカルボジイミド)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、DEPC(シアノリン酸ジエチル)等を例示することができ、その使用量は、一般式(III-1)又は一般式(III-2)で表されるフタル酸アミド誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

[0040]

本反応で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は、一般式(III-1) 又は一般式(III-2) で表されるフタル酸アミド誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間 は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲である。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

[0041]

以下に一般式(IV')で表される複素環アミン誘導体の代表的な化合物を第1表に、一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体の代表的な化合物を第2表~第12表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の表において、Meとはメチルを、Etとはエチルを、Prとはプロピルを、Buとはブチルを、Acとはアセチルを、Phとはフェニルを、cーは脂環式炭化水素を示し、Noは化合物番号を、mpは融点を、nDは屈折率を示す。

[0042]

一般式(IV'):

【化19】

$$Q' - NH_{2}$$

$$Q' : \frac{3}{11} \frac{1}{6} \frac{1}{6} \frac{1}{12} \frac$$

[0043]

第1表

No.	Q'	Ym	mp(℃) 又は ¹ H-NMR [δ値(ppm/CDCl ₃)]
IV-1	Q26	3 -Me- 5 - $\mathrm{C_2F_5}$	2.17(s.3H), 4.82(br.2H), 7.42(d.1H),
			8.16(s.1H).
IV-2	Q26	3 –Me- 5 – n – C_3 F_7	2.18(s.3H), 4.94(br.2H), 7.41(d.1H),
			8.19(s.1H).
IV-3	Q26	3-Me-5-i-C ₃ F ₇	2.18(s.3H), 4.80(br.2H), 7.42(d.1H),
	-		8.15(s.1H).

【0044】 第1表 (続き)

No.	Q'	Ym	mp(℃) 又は ¹ H-NMR [δ値(ppm/CDCl ₃)]
IV-4	Q27	2-n-C ₃ F ₇	4.08(br.2H), 7.04(dd.1H), 7.43(d.1H),
			8.16(d.1H).
I V- 5	Q27	6-C1-2-n-C ₃ F ₇	4.65(br.2H), 7.17(d.1H), 7.57(d.1H).
I V- 6	Q27	$2-C_2F_5$	3.72(br.2H), 7.04(dd.1H), 7.46(d.1H),
			8.16(d.1H).
IV-7	Q27	$2-i-C_3F_7$	4.12(br.2H), 7.06(dd.1H), 7.44(dd.1H),
			8.13(d.1H).
1 V -8	Q27	$4-Me-2-i-C_3F_7$	2.22(s.3H), 4.12(br.2H), 7.34(d.1H),
			8.07(s.1H).
I V -9	Q27	$4-Me-6-i-C_3F_7$	2.21(s.3H), 4.26(br.2H), 7.09(dd.1H),
			7.98(d.1H).
IV-10	Q27	6 -Me- 2 - i - C_3 F $_7$	2.42(s.3H), 4.12(br.2H), 6.98(d.1H),
			7.31(dd.1H).
IV-11	Q27	6-C1-2-i-C ₃ F ₇	4.40(br.2H), 7.12(d.1H), 7.41(dd.1H).
IV-12	Q27	6 -F-2- i - C_3 F $_7$	
IV-13	Q27	$6-i-C_3F_7$	4.28(br.2H), 7.04(dd.1H), 7.18(m.1H),
			8.07(d.1H).
IV-14	Q27	4,6-Cl ₂ -2-i-C ₃ F ₇	4.80(br.2H), 7.53(d.1H).
I V -15	Q27	6 -Me 0 - 2 -i- $\mathrm{C_3F_7}$	3.96(s.3H), 4.03(br.2H), 6.91(d.1H),
			7.10(dd.1H).
I V -16	Q27	$6-\text{MeS}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	2.58(s.3H), 4.00(br.2H), 6.91(d.1H),
			7.22(dd.1H).
IV-17	Q27	6-MeSO-2-i-C ₃ F ₇	······································

[0045]

第1表 (続き)

No.	Q'	Ym	mp(℃) 又は ¹ H-NMR [δ値(ppm/CDCl ₃)]
IV-18	Q27	$6\text{-MeSO}_2\text{-}2\text{-}i\text{-}\mathrm{C}_3\mathrm{F}_7$	
IV-19	Q32	4 -Me- 2 - i - C_3 F $_7$	2.46(s.3H), 3.94(br.2H), 8.15(s.1H).
IV-20	Q32	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	2.49(s.3H), 4.35(br.2H), 8.55(s.1H).
I V -21	Q34	5-i-C ₃ F ₇	5.0(br.2H), 8.01(s.1H), 8.31(s.1H).
IV-22	Q27	2-0CF ₂ CHF ₂	3.43(br.2H), 6.13(tt.1H), 6.88(d.1H),
			7.08(dd.1H), 7.74(d.1H).
IV-23	Q27	2-0CHF ₂	3.60(br.2H), 6.72(d.1H), 7.07(dd.1H),
			7.26(dd.1H), 7.63(d.1H).
IV-24	Q27	6-Me-2-OCHF ₂	1.30(s.3H), 3.45(br.2H), 6.58(d.1H),
			6.98(d.1H), 7.30(t.1H).
IV-25	Q27	2-SCHF ₂	3.81(br.2H), 6.94(dd.1H), 7.24(t.1H),
			7.25(d.1H), 8.06(d.1H).
IV-26	Q27	6-Me-2-SCHF ₂	44-46℃
IV-27	Q27	2-OCH(CF ₃) ₂	3.70(br.2H), 6.40(m.1H), 6.76(d.1H),
			7.08(dd.1H), 7.59(d.1H).
IV-28	Q27	$6\text{-Me-}2\text{-OCH(CF}_3)_2$	2.33(s.3H), 3.45(br.2H), 6.49(m.1H),
			6.64(d.1H), 7.03(d.1H).
I V -29	Q27	6-C1-2-OCH(CF ₃) ₂	3.89(br.2H), 6.24(m.1H), 6.76(d.1H),
			7.16(d.1H).
IV-30	Q27	6-F-2-OCH(CF ₃) ₂	• •
IV-31	Q27	6 -OMe-2-OCH(CF $_3$) $_2$	
IV-32	Q27	6-C1-2-SCH(CF ₃) ₂	
IV-33	Q27	6-Me-2-SCH(CF ₃) ₂	

[0046]

第1表(続き)

No. Q' Ym

mp(℃) 又は¹H-NMR [δ値(ppm/CDCl₃)]

IV-34 Q27 $6-F-2-SCH(CF_3)_2$ IV-35 Q27 $6-OMe-2-SCH(CF_3)_2$

[0047]

一般式(I):

【化20】

$$Xn = \begin{bmatrix} Z^1 \\ N(R^1)R^2 \\ N(R^3)Q \end{bmatrix}$$

$$Q = \begin{bmatrix} 3 & 4 & 4 \\ Ym & 3 & 4 \\ Ym & 5 & 2 & 4 \\ 1 & & 1 \end{bmatrix}$$

$$Q1 = Q2$$

【0048】 第2表 (Z¹=Z²=0)

Q	No.	Χn	R	1 _R 2	R^3	W	Ym	mp(℃)
Q1	1-1	3-C1	H	i-Pr	Н	0	Н	
Q1	1-2	3-C1	H	i–Pr	H	0	3-Me-5-C ₂ F ₅	
Q1	1-3	3-C1	H	i-Pr	H		4,5-Br ₂	143
Q1	1-4	3-Br	H	i-Pr	H	0	$3-Me-5-n-C_3F_7$	
Q1	1-5	3-NO ₂	H	i-Pr	H	0	$3-Me-5-i-C_3F_7$	
Q1	1-6	3-I	H	i-Pr	H	S	H .	
Q1	1-7	3-I	H	i-Pr	H	S	3-Ме	207
Q1	1-8	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C1	
Q1	1-9	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C ₂ F ₅	
Q1	1-10	3-I	H	i–Pr	H	S	$5-n-C_3F_7$	
Q1	1-11	3-I	H	i-Pr	H	S	$5-i-C_3F_7$	
Q1	1-12	3-I	H	i-Pr	H	S	3-Me-5-t-Bu	160
Q1	1-13	3-I	H	i-Pr	H	S	3-Me-5-Br	-
Q1	1-14	3-I	H	i-Pr	H	S	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q1	1-15	3-I	Ħ	i-Pr	H	S	$3-Me-5-n-C_3F_7$	
Q1	1-16	3-I	H	i-Pr		S		
Q1	1-17	3-I	H	i-Pr	H	S	$3-Me-4-C_2F_5$	
Q1	1-18	3-I	H	i-Pr	H	S	$3-Me-4-n-C_3F_7$	
Q1	1-19	3-I	H	i-Pr	H	S	$3-Me-4-i-C_3F_7$	
Q1	1-20	3-I	H	t-Bu	H	NMe	5-i-C ₃ F ₇	
							5-C ₂ F ₅	
Q1	1-22	3-I	H	t-Bu	H	NMe	5-n-C ₃ F ₇	
Q1	1-23	3-I	H	t-Bu	H	NMe	3-Me-5-i-C ₃ F ₇	

【0049】 第2表 (続き)

Q	No.	Χn	\mathbb{R}^1	R^2	R ³	W :	Ym	mp(℃)
Q1	1-24	3-I	Н	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	S	3-Me-5-i-($^{\mathrm{L}_{3}\mathrm{F}_{7}}$
Q1	1-25	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SOCH ₃	H	S	3-Me-5-i-(^C 3 ^F 7
Q1	1-26	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ CH ₃	H	S	3-Me-5-i-(^C 3 ^F 7
Q1	1-27	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SСН ₃	H	S	3-Me-5-i-(^C 3 ^F 7
Q1	1-28	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SOCH ₃	H	S	3-Me-5-i-(C ₃ F ₇
Q1	1-29	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	S	3-Me-5-i-(^C 3 ^F 7
Q1	1-30	3-I	H	CH(CH3)CH2NHAc	H	S	3-Me-5-i-(^C 3 ^F 7
Q1	1-31	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	S	3-Me-5-i-0	$^{\mathrm{C}_{3}\mathrm{F}_{7}}$
Q1	1-32	3-I	H	сн (сн ₃) сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	S	3-Me-5-i-(^C 3 ^F 7
Q1	1-33	3-I	H	с (сн ₃) 2 сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	S	3-Me-5-i-($^{\complement}3^{F}7$
Q1	1-34	3-I	Et	Et	H	0	H	
Q1	1-35	3-I	Et	Et	H	0	3-Me-5-C ₂ 1	^F 5
Q1	1-36	3-I	Et	Et	H	0	3-Me-5-n-0	^C 3 ^F 7
Q1	1-37	3-I	Et	Et	H	0	3-Me-5-i-	$^{\text{C}}3^{\text{F}}7$
Q1	1-38	3-I	Et	Et	Ħ	0	5-C1	
Q1	1-39	3-I	Et	Et	H	0	5–Br	•
Q1	1-40	3-I	Et	Et	H	0	$5-n-C_3F_7$	
Q1	1-41	6-I	H	i-Pr	H	S	3-Me-5-t-	B u 97
Q1	1-42	6-I	H	i-Pr	H	S	3-Me	168
Q1	1-43	3-CF ₃	H	i-Pr	H	NMe	3-Me-5-C ₂	F ₅
		3-Ph					3-Me-5-n-	_
							3-Me-5-i-	
			_	H i-Pr				_

【0050】 第2表 (続き)

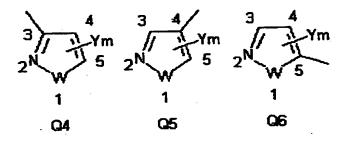
Q	No.	Χn			R^1	R^2	R^3	W	Ym	$\mathtt{mp}(\mathbb{C})$
Q1	1-47	3-I-	4-C	1	Н	i-Pr	Н	NMe	3-Me	-5-n-C ₃ F ₇
Q1	1-48	3-I-	4– C	F ₃	H	i-Pr	H	S	3-Me	-5-i-C ₃ F ₇
Q1	1-49	3-CF	3 ⁻⁴	-C1	H	i-Pr	H	S	3-Me	-5-C ₂ F ₅
Q1	1-50	3-0C	F ₂ 0	-4	H	i-Pr	H	S	3-Ne	-5-n-C ₃ F ₇
Q1	1-51	3-0C	F_2^C	F ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	3-Ne	-5-i-C ₃ F ₇
Q2	2- 1	3-I			H	i-Pr	H	S	2-Me	-5-C ₂ F ₅
Q2	2- 2	3-I			H	i-Pr	H	S	2-Ne	-5-n-C ₃ F ₇
Q2	2- 3	3-I			H	i-Pr	H	S	2-Me	-5-i-C ₃ F ₇
Q2	2- 4	3-I			H	i-Pr	H	S	4-Me	-5-C ₂ F ₅
Q2	2- 5	3-I			H	i-Pr	H	S	4-Me	-5-n-C ₃ F ₇
Q2	2- 6	3-I			H	i-Pr	H	S	4-Me	-5-i-C ₃ F ₇
Q2	2- 7	3-I			H	t-Bu	H	NMe	5-i-	C ₃ F ₇
Q2	2- 8	3-I			H	t-Bu	H	NMe	5-C ₂	F ₅
Q2	2- 9	3-I			H	t-Bu	H	NMe	5-n-	^C 3 ^F 7
Q2	2-10	3-I			H	t-Bu	H	NMe	4-Me	-5-i-C ₃ F ₇
Q2	2-11	3-I	H	CH (CH	(₃) CI	H ₂ SCH ₃	H	S	4-Me	-5-i-C ₃ F ₇
Q2	2-12	3-I	H	СН (СН	(₃) CI	H ₂ SOCH ₃	H	S	4-Me-5	-i-C ₃ F ₇
Q2	2-13	3-I	H	CH (CH	(₃) CI	H ₂ SO ₂ CH ₃	H	S	4-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q2	2-14	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CI	H ₂ SCH ₃	H	S 4	4-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q2	2-15	3-I	H	C (CH ₃) ₂ CI	H ₂ SOCH ₃	H	S	2-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q2	2-16	3-I	H	C (CH _S) ₂ CI	1 ₂ SO ₂ СН ₃	H	S	2- Me- 5	-i-c ₃ F ₇
Q2	2-17	3-I	H	СН (СН	(₃) CI	H ₂ NHAc	H	S	2- Me- 5	-i-c ₃ F ₇
Q2	2-18	_3-I	H	C (CH ₅) ₂ CI	H ₂ NHAc	_H_	S	2-Me-5	-i-C ₃ F ₇

【0051】 第2表(続き)

Q	No.	Xn	R^1	R^2	R ³	W	Ym	mp(℃)
Q2	2-19	3-I	H	си (си ₃) си ₂ си ₂ оси ₃	H	s	$2-Me-5-i-C_3F_7$	
Q2	2-20	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	S	$4-\text{Me}-5-i-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q2	2-21	3-I	Et	Et	H	0	H	
Q2	2-22	3-I	Et	Et	H	0	$2\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q2	2-23	3-I	Et	Et	H	0	2-Me-5-n-C ₃ F ₇	
Q2	2-24	3-I	Et	Et	H	.0	4-Me-5-i-C ₃ F ₇	

[0052]

【化21】



【0053】 第3表 (Z¹=Z²=0)

Q	No.	Χn	R^1	\mathbb{R}^2	R^3	W	Ym	mp(℃)
Q4	4-1	H	Н	i-Pr	Н	0	5-Me	185
Q4	4-2	3-C1	H	i-Pr	H	0	H	
Q4	4-3	3-C1	H	i-Pr	H	0	$4-Me-5-C_2F_5$	
Q4	4-4	3-C1	H	i-Pr	H	0	4,5-Br ₂	
Q4	4-5	3-C1	H	i-Pr	H	0	5- Me	136
Q4	4–6	3-C1	H	i-Pr	H	0	5-(4-Br-Ph)	158
Q4	4-7	3-C1	H	i-Pr	H	0	4-Me-5-(4-Cl-Ph)	184
Q4	4-8	6-C1	H	i-Pr	H	0	4-Me-5-(4-Cl-Ph)	101
Q4	4-9	3-Br	H	i-Pr	H	0	4 –Me- 5 – n – C_3 F $_7$	
Q4	4-10	$3-NO_2$	H	i-Pr	H	0	4 -Me- 5 - i - C_3 F $_7$	
Q4	4-11	3-I	H	i-Pr	H	0	4-Me	144
Q4	4-12	3-I	H	i-Pr	H	0	4-Me-5-CF ₃	151
Q4	4-13	3-I	H	i-Pr	H	S	H	
Q4	4-14	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me	
Q4	4-15	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C1	
Q4	4-16	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C ₂ F ₅	
Q4	4-17						5-n-C ₃ F ₇	
Q4	4-18	3-I	H	i-Pr	H	S	5-i-C ₃ F ₇	
Q4	4-19	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-t-Bu	
Q4	4-20	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-Br	
Q4	4-21	3-I	H	i-Pr	H	S	$4\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q4	4-22	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-n-C ₃ F ₇	
							4-Me-5-i-C ₃ F ₇	

【0054】 第3表(続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	W	Ym mp	(C)
Q4	4-24	3-I	Н	t-Bu	Н	NMe	5-i-C ₃ F ₇	
Q4	4-25	3-I	H	t-Bu	H	NMe	$5-c_2^{F_5}$	
Q4	4-26	3-I	H	t-Bu	H	NMe	$5-n-C_3F_7$	
Q4	4-27	3-I	H	t-Bu	H	NMe	${\small 4\text{-Me-}5\text{-}i\text{-}C_{3}F_{7}}$	
Q4	4-28	3-I	H	СН(СН ₃)СН ₂ SCH	H	S	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-29	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SOCН ₃	H	S	$^{4\text{-Me-}5\text{-}i\text{-}C}3^{F}7$	
Q4	4-30	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH_3})\mathrm{CH_2}\mathrm{SO_2}\mathrm{CH_3}$	H	S	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-31	3-I	H	${\tt C(CH_3)_2CH_2SCH_3}$	H	S	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-32	3-I	H	$\mathrm{C}(\mathrm{CH_3})_2\mathrm{CH_2}\mathrm{SOCH_3}$	Ħ	S	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-33	3-I	H	${\rm C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3}$	H	S	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-34	3-I	H	CH(CH3)CH2NHAc	H	S	$^{4\text{-Me-}5\text{-i-C}_3F_7}$	
Q4	4-35	3-I	H	$C(CH_3)_2CH_2NHAc$	H	S	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-36	3-I	H	$\mathtt{CH}(\mathtt{CH}_3)\mathtt{CH}_2\mathtt{CH}_2\mathtt{OCH}_3$	H	S	$^{4\text{-Me-}5\text{-}i\text{-}C}3^{F}7$	
Q4	4-37	3-I	H	$\mathtt{C(CH_3)_2CH_2CH_2OCH_3}$	H	S	$4-Me-5-i-C_3F_7$	
Q4	4-38	3-I	Et	Et	H	0	H .	
Q4	4-39	3-I	Et	Et	H	0	$4\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	•
Q4	4-40	3-I	Et	Et	H	0	$4-Me-5-n-C_3F_7$	
Q4	4-41	3-I	Et	Et	H	0	$4\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q4	4-42	3-I	Et	Et	H	0	5-C1	
Q4	4-43	3-I	Et	Et	H	0	5-Br	
Q4	4-44	3-I	Et	Et	H	0	$5-n-C_3F_7$	
Q4	4-45	6-I	H	i-Pr	H	0	4-Me-5-CF ₃	14
Q4	4-46	3-CF	, H	i-Pr	H	NMe	4-Me-5-C ₂ F ₅	

【0055】 第3表(続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R	3 W	Ym l	(℃)
Q4	4-47	3-Ph	Н	i-Pr	Н	NMe	4-Me-5-n-	-C ₃ F ₇
Q4	4-48	3-SOCF ₃	H	i-Pr	H	NMe	4-Me-5-i-	-c ₃ F ₇
Q4	4-49	$3-C_2F_5$	H	i-Pr	H	NMe	4-Me-5-C	2 ^F 5
Q4	4-50	3-I-4-C1	H	i-Pr	H	NMe	4-Me-5-n-	-C ₃ F ₇
Q4	4-51	3-I-4-CF ₃	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-i-	-c ₃ F ₇
Q4	4-52	3-CF ₃ -4-C1	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-C	2 ^F 5
Q4	4-53	3-0CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-n-	-c ₃ F ₇
Q4	4-54	3-0CF ₂ CF ₂ 0	-4 H	i-Pr	H	S	4-Me-5-i-	-c ₃ F ₇
Q5	5- 1	3-C1	H	i-Pr	H	0	H	
Q5	5- 2	3-C1	H	i-Pr	H	0	3-Me-5-C	l
Q5	5- 3	3-C1	H	i-Pr	H	0	3,5-Br ₂	
Q5	5- 4	3-C1	H	i-Pr	H	NMe	3-Me	180
Q5	5- 5	3-C1	H	i-Pr	H	NMe	3-Me-5-0	le 220
Q5	5- 6	3-C1	H	n-Pr	H	NMe	3-Me-5-0	le 90
Q5	5- 7	3-C1	H	n-Pr	H	NMe	3-Me-5-0	Ph 190
Q5	5- 8	6-C1	H	i-Pr	H	NMe	3-Me-5-0	Ph 245
Q5	5- 9	6-C1	H	i-Pr	H	NMe	3-Me-5-0	e 175
Q5	5-10	3-Br	H	i-Pr	H	0	$3,5-{ m Me}_2$	
Q5	5-11	3-NO ₂	H	i-Pr	H	0	$3,5-{ m Me}_2$	
Q5	5-12	3-I	H	i-Pr	H	0	3-CF ₃	
Q5	5-13	3-I	H	i-Pr	H	0 -	5-CF ₃	
Q5	5-14	3-I	H	i–Pr	H	S	H	
Q5	5-15	3-I	Н	i-Pr	H	S	3-Me	



【0056】 第3表 (続き)

Q	No.	Χn	F	R ¹ R ²	R ³	W	Ym			$\mathtt{mp}(\mathbb{C})$
Q 5	5-16	3-I	Н	i-Pr	.,			Н	S	5-C1
Q5	5-17	3-I	H	i–Pr				H	S	5-C ₂ F ₅
Q5	5-18	3-I	H	i–Pr				H	S	5-n-C ₃ F ₇
Q5	5-19	3-I	H	i–Pr				H	S	5-i-C ₃ F ₇
Q5	5-20	3-I	H	i–Pr				H	S	3-C ₂ F ₅
Q5	5-21	3-I	H	i–Pr	•			H	S	$3-n-C_3F_7$
Q5	5-22	3-I	H	i–Pr				H	Ś	3-i-C ₃ F ₇
Q5	5-23	3-I	H	i–Pr				H	S	3-Me-5-Br
Q5	5-24	3-I	H	i–Pr				H	S	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$
Q5	5-25	3 –I	H	i–Pr				H	S	$3-Me-5-n-C_3F_7$
Q5	5-26	3-I	H	i–Pr				H	S	$3\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$
Q5	5-27	3-I	H	t-Bu				H -	NMe	$5-i-C_3F_7$
Q5	5-28	3-I	H	t-Bu				H	NMe	$5 - {^{\rm C}2}{^{\rm F}5}$
Q5	5-29	3-I	H	t-Bu				H	NMe	5 -n- $\mathrm{C_3F_7}$
Q5	5-30	3-I	H	СН (СН	3) CH ₂	SCH	3	H	NMe	$3,5-{ m Me}_2$
Q5	5-31	3-I	H	СН (СН	3) CH ₂	SOC	H ₃	H	NMe	3,5-Me ₂
Q5	5-32	3-I	H	СН (СН	3) CH2	2S02	CH ₃	H	NMe	3,5-Me ₂
Q5	5-33	3-I	H	С(СН3) ₂ CH ₂	SCH	3	H	NMe	3,5-Me ₂
Q5	5-34	3-I	H .	с(сн3) ₂ CH ₂	SOC	H ₃	H	NMe	3,5-Me ₂
Q5	5-35	3-I	H	С(СH3) ₂ CH ₂	2S02	CH ₃	H	NMe	3,5-Me ₂
Q5	5-36	3-I	H	СН (СН	3) CH ₂	NHA	С	H	NMe	$3,5-{ m Me}_2$
Q5	5-37	3-I	H	C(CH3) ₂ CH ₂	NHA	С	H	NMe	$3,5-{ m Me}_2$
Q5	5-38	3-I	Н_	СН (СН	3) CH.	CH ₂ C	OCH ₂	_H_	NMe	3,5-Me ₂

【0057】 第3表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1		R^2	R^3	W	Ym mp(°C)
Q 5	5-39	3-I	н с(сн ₃)	2 ^{CH} 2	сн ₂ осн	3 H	NMe	3,5-Me ₂
Q5	5-40	3-I		Et	Et	H	0	H
Q5	5-41	3-I		Et	Et	H	0	$3-Me-5-C_2F_5$
Q5	5-42	3-I		Et	Et	H	0	$3-Me-5-n-C_3F_7$
Q5	5-43	3-I		Et	Et			$3-Me-5-i-C_3F_7$
Q5	5-44	3-I		Et	Et	H	0	5-CI
Q 5	5-45	3-I		Et	Et	H	0	5-Br
Q5	5-46	3-I		Et	Et	H	0	5-n-C ₃ F ₇
Q5	5-47	3-I		Et	Et	H	0	5-n-C ₃ F ₇
Q5	5-48	3-CF	3	H	i-Pr	H	NMe	3-Me-5-C ₂ F ₅
Q5	5-49	3-Pł	1	H	i-Pr	H	NMe	3-Me-5-n-C ₃ F ₇
Q5	5-50	3-S0	CF ₃	H	i-Pr	H	NMe	$3-Me-5-i-C_3F_7$
Q5	5-51	3-C ₂	2 ^F 5	H	i-Pr	H	NMe	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$
Q5	5-52	3-I-	-4-C1	H	i-Pr	H	NMe	3 –Me– 5 – n – C_3 F_7
Q5	5-53	3-I-	-4-CF ₃	H	i-Pr	H	S	$3-Me-5-i-C_3F_7$
Q5	5-54	3-CI	-3-4-C1	H	i-Pr	H	S	3-Me-5-C ₂ F ₅
Q5	5-55	3-00	CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	3-Me-5-n-C ₃ F ₇
Q5	5-56	3-00	CF ₂ CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	$3-Me-5-i-C_3F_7$
Q6	6- 1	3-C1	_ l .	H	i-Pr	H	0	Н
Q6	6- 2	3-C	1	H	i-Pr	H	0	4 –Me- 3 – C_2 F_5
Q6	6- 3	3-C	l	Н	i-Pr	H	0	3,4-Br ₂
Q6	6- 4	3-B1	r	H	i-Pr	H	0	4 -Me-3-n- C_3 F $_7$
Q6	6- 5	3-N(),	H	i-Pr	H		4-Me-3-i-C ₃ F ₇

【0058】 第3表 (続き)

Q	No.	χn	R^1	R^2	R^3	W	Ym	mp	(°C)
Q6	6- 6	3-NO) ₂ H	i-Pr	H	NMe	3-Me	176	-
Q6	6- 7	3-I	H	i-Pr	H	0	4-Me-3-Et	85	
Q6	6- 8	3-I	H	i-Pr	H	0	4 -Me- 3 -CF $_3$	103	
Q6	6- 9	3-I	H	i-Pr	H	S	H		
Q6	6-10	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me		
Q6	6-11	3-I	H	i-Pr	H	S	3-C1		
Q6	6-12	3-I	H	i-Pr	H	S	$3-C_2F_5$		
Q6	6-13	3-I	H	i-Pr	H	S	$3-n-C_3F_7$		
Q6	6-14	3-I	H	i-Pr	H	S	3-n-C ₃ F ₇ 3-i-C ₃ F ₇		
Q 6	6-15	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-3-t-Bu		
Q6	6-16	3-I	H .	i-Pr	H	S	4-Me-3-Br		
Q6	6-17	3-I	H	i-Pr	H	S	$4\text{-Me-}3\text{-C}_2F_5$	-	
Q6	6-18	3-I	H	i–Pr	H	S	4-Me-3-n-C ₃ F	7	
Q6	6-19	3-I	H	i–Pr	H	S	4-Me-3-i-C ₃ I	7	
Q6	6-20	3-I	H	t-Bu	H	NMe	3-i-C ₃ F ₇		
Q6	6-21	3-I	H	t-Bu	H		3-C ₂ F ₅		
Q6	6-22	3-I	H	t-Bu	H		3-n-C ₃ F ₇		
Q6	6-23	3-I	H	t-Bu	H	NMe	4-Me-3-i-C ₃ F	7	
Q6	6-24	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	S	4-Me-3-i-C ₃ I	7	
Q6	6-25	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SOCH ₃	H	S	4-Me-3-i-C ₃ I	•	
Q6	6-26	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ CH ₃			_	•	
Q6				C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃			4-Me-3-i-C ₃ I	•	
Q 6				C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃		S	4-Me-3-i-Cal	· .	

【0059】 第3表(続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	W	Ym	mp(℃)
Q6	6-29	3-I	Н	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	Н	S	4-Me-3-	i-C ₃ F ₇
Q6	6-30	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	S	4-Me-3- i	i-C ₃ F ₇
Q6	6-31	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	S	4-Me-3- i	i-C ₃ F ₇
Q6	6-32	3-I	H	$\mathtt{CH}(\mathtt{CH}_3)\mathtt{CH}_2\mathtt{CH}_2\mathtt{OCH}_3$	H	S	4-Me-3 -3	i-C ₃ F ₇
Q6	6-33	3-I	H	$\mathtt{C(CH_3)}_2\mathtt{CH}_2\mathtt{CH}_2\mathtt{OCH}_3$	H	S	4-Me-3-	i-C ₃ F ₇
Q6	6-34	3-I	Et	Et	H	0	H	
Q6	6-35	3-I	Et	Et	H	0	4-Me-3	3-C ₂ F ₅
Q6	6-36	3-I	Et	Et	H	0	4-Me-	3-n-C ₃ F ₇
Q6	6-37	3-I	Et	Et	H	0	4-Me-	3-i-C ₃ F ₇
Q6	6-38	3-I	Et	Et	H	0	3-C1	
Q6	6-39	3-I	Et	Et	H	0	3-Br	
Q6	6-40	3-I	Et	Et	H	0	3-n-C	3 ^F 7
Q6	6-41	3-CF	3 H	i–Pr	H	NM	e 4-Me-	3-C ₂ F ₅
Q6	6-42	3-Ph	Н	i–Pr	H	NM	e 4-Me-	3-n-C ₃ F ₇
Q6	6-43	3-S0	CF ₃	H i-Pr	H	NM	e 4-Me-	3-i-C ₃ F ₇
Q 6	6-44	3-C ₂	F ₅	H i-Pr	H	NM	e 4-Me-	3-C ₂ F ₅
Q6	6-45	3-I-	4-C	l H i-Pr	H	NM	e 4-Me-	3-n-C ₃ F ₇
Q6	6-46	3-I-	4 –C	F ₃ H i-Pr	H	S	4-Me-	3-i-C ₃ F ₇
Q6	6-47	3-CF	₃ -4	-Cl H i-Pr	H	S	4-Ne-	3-C ₂ F ₅
Q6	6-48	3-00	F ₂ 0	-4 H i-Pr	H	S	4-Me-	3-n-C ₃ F ₇
Q6	6-49	3-00	F ₂ C	F ₂ 0-4 H i-Pr	H	S	4-Me-	3-i-C ₃ F ₇

[0060]

【化22】

第4表 $(Z^1 = Z^2 = 0)$

Q	No.	Xn	R^1	R ²	R ³	W	Уm	mp(℃)
Q8	8- 1	3-C1	Н	i-Pr	H	S	H	137
Q8	8- 2	3-C1	H	i-Pr	H	S	4-Me	175
Q8	8- 3	3-C1	H	i-Pr	H	S	4-CF ₃	185
Q8	8- 4	3-C1	H	i-Pr	H	S	4-Ph	175
Q8	8- 5	3-C1	H	i-Pr	H	S	4-Ph-5-Cl	205
Q8	8- 6	3-C1	H	i-Pr	H	0	4-Me-5-Cl	
Q8	8- 7	3-C1	H	i-Pr	H	0	4,5-Br ₂	
Q8	8-8	3-C1	H	i-Pr	H	NMe	4-Ne	
Q8	8- 9	3-C1	H	i-Pr	H	NMe	4-Me-5-0Me	
Q8	8-10	3-C1	H	n-Pr	H	NMe.	4-Ne-5-0Ne	
Q8	8-11	3-C1	H	n-Pr	H	NMe	4-Me-5-0Ph	
Q8	8-12	6-C1	H	i-Pr	H	S	4-CH ₃	155
Q8	8-13	6-C1	H	i-Pr	H	S	4-CF ₃	165
Q8	8-14	6-C1	H	i-Pr	H	S	4-Ph	155
Q8	8-15	6-C1	H	i-Pr	H	S	4-Ph-5-C1	155
Q8	8-16	3-Br	H	i-Pr	H	0	4,5-Me ₂	
Q8_	8-17	3-NO ₂	H	i-Pr	_H_	0	4,5-Me ₂	

【0061】 第4表 (続き)

Q	No.	Χn	R ¹	R ²	R ³	W	Ym .	mp(℃)
Q8	8-18	3-I	Н	i–Pr	H	0	4-CF ₃	
8(8-19	3-I	H	i-Pr	H	0	5-CF ₃	
8	8-20	3-I	H	i-Pr	H	S	H	
J 8	8-21	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me	
28	8-22	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C1	
8	8-23	3-I	H	i-Pr	H	S	$5-C_2F_5$	
8	8-24	3-I	H	i-Pr	H	S	$5-n-C_3F_7$	
Q8	8-25	3-I	H	i-Pr	H	S	$5-i-C_3F_7$	
Q8	8-26	3-I	Ĥ	i-Pr	H	S	$4- C_2 F_5$	
98	8-27	3-I	H	i-Pr	H	S	4-n-C ₃ F ₇	•
Q8	8-28	3-I	H	i-Pr	H	S	$4-i-C_3F_7$	
28	8-29	3-1	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-Br	•
28	8-30	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-C ₂	2 ^F 5
Q8	8-31	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Ne-5-n-	^{-C} 3 ^F 7
Q8	8-32	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-i-	-C ₃ F ₇
Q8	8-33	3-I	H	t-Bu	H	NMe	$5-i-C_3F_7$	
Q8	8-34	3-I	H	t-Bu	H	NMe	$5-C_2F_5$	
Q8	8-35	3-I	H	t-Bu	H	NMe	5-n-C ₃ F ₇	
Q8	8-36	3-I	H	СН(СН ₃)СН ₂ SCH ₃	H	NMe	$4,5-\text{Me}_2$	
Q8	8-37	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	NMe	$4,5-{ m Me}_2$	
Q 8	8-38	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SOCH ₃	H	NMe	$4,5-\text{Me}_2$	
Q8	8-39	3-I	Н	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	NMe	$4,5-\text{Me}_2$	
Q8	8-40	_3-I	Н	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	H	NMe	4,5-Me,	

【0062】 第4表(続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	W	Ym	mp(℃
Q8	8-41	3-I	Н	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	Н	NMe	4,5-	Me ₂
Q8	8-42	3-I	H	CH(CH3)CH2NHAC	H	NMe	4,5-	$^{ exttt{Me}}_2$
Q8	8-43	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	NMe	4,5-	$^{ exttt{Me}}_2$
Q8	8-44	3-I	Ħ	сн (сн ₃) сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	NMe	4,5-	$^{ exttt{Me}}_2$
Q8	8-45	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	NMe	4,5-	$^{ exttt{Me}}_2$
Q8	8-46	3-I	Et	Et	H	0	H	
Q8	8-47	3-I	Et	Et	H	0	5-C ₂	F ₅
Q8	8-48	3 –I	Et	Et	H	0	4-n-	^C 3 ^F 7
Q8	8-49	3-I	Et	Et	H	0	4-i-	^C 3 ^F 7
Q8	8-50	3 –I	Et	Et	H	0	5-C1	
Q8	8-51	3-I	Et	Et	H	0	5-Br	
Q8	8-52	3-I	Et	Et	H	0	5-n-	^C 3 ^F 7
Q8	8-53	3-I	Et	Et	H	S 4	-(4-C	l-Ph)
Q8	8-54	3-CF ₃	H	i-Pr	H	NMe	5-C ₂	F ₅
Q8	8-55	3-Ph	H	i–Pr	H	NMe	4-n-	$^{\mathrm{C}}_{3}^{\mathrm{F}}_{7}$
Q8	8-56	3-SOCF ₃	H	i-Pr	H	NMe	4-i-	^C 3 ^F 7
Q8	8-57	$3-C_2F_5$	H	i-Pr	H	NMe	5-C ₂	F ₅
Q8	8-58	3-I-4-C1	H	i-Pr	H	NMe	4-n-	€ ₃ F ₇
Q8	8-59	3-I-4-CF ₃	H	i-Pr	H	S	4-i-	^C 3 ^F 7
Q8	8-60	3-CF ₃ -4-C	1	H i-Pr	H	S	5-C ₂	F ₅
Q8	8-61	3-0CF ₂ 0-4		H i-Pr	H	S	4-n-	C ₃ F ₇
Q8	8-62	3-0CF ₂ CF ₂	0-4	∦ i–Pr	H	S	4-i-	^C 3 ^F 7
		3-I		H i-Pr	H_	S	4-S-	Et

【0063】 第4表(続き)

Q	No.	Xn	R^1	R ²	R ³	W	Ym	mb(℃)
Q8	8-64	6-I	Н	i-Pr	Н	S	4-S-Et	135
Q 8	8-65	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-5-CO ₂ -Et	
								定形固体
Q 9	9- 1	3-C1	H	i-Pr	H	0	H	
Q 9	9- 2	3-C1	H	i-Pr	H	0	$5\text{-Me-}2\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q9	9- 3	3-C1	H	i-Pr	H	0	2,5-Br ₂	
Q9	9- 4	3-C1	H	i-Pr	H	S	2-Ph	131
Q9	9- 5	3-Br	H	i-Pr	H	0	$5-Me-2-n-C_3F_7$	
Q9	9- 6	3-NO ₂	H				$5-Me-2-i-C_3F_7$	
Q9	9- 7	3-I	H	i-Pr	H	0	5 -Me- 2 -CF $_3$	
Q9	9- 8	3-I	H	i-Pr	H	S	H	
Q9	9- 9	3-I	H	i-Pr	H	S	2-Me	
Q 9	9-10	3-I	H	i-Pr	H	S	2-C1	
Q9	9-11	3-I	H	i-Pr	H	S	$2-c_2^{}$ F $_5$	
Q9	9-12	3-I	H	i-Pr	H	S	$2-n-C_3F_7$	
Q9	9–13	3-I	H	i-Pr	H	S	$2-i-c_3F_7$	
Q9	9–14	3-I	H	i-Pr	H	S	5-Me-2-t-Bu	
Q9	9-15	3-I	H	i-Pr	H	S	5-Me-2-I 135	
Q9	9-16	3-I	H	i-Pr	H	S	$5\text{-Me-}2\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q9	9-17	3-I	H	i-Pr	H	S	$5\text{-Me-}2\text{-}\text{n-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q 9	9–18	3-I	H	i-Pr	H	S	$5-Me-2-i-C_3F_7$	
Q 9	9–19	6-I	H	i-Pr	H	S	5-Me-2-I	191
Q9	9-20	3-I_	H	t-Bu	<u>H</u> _	NMe	2-i-C ₃ F ₇	

【0064】 第4表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2		R^3	W	Ym	mp(℃)
Q 9	9-21	3-I	Ħ	t-	Bu	Н.	NMe	2-C ₂ F ₅	
Q9	9-22	3-I	H	t-	Bu	H	NMe	2-n-C ₃ F ₇	
Q9	9-23	3-I	H	t-	Bu	H	NMe	5-Me-2-i	-C ₃ F ₇
Q9 .	9-24	3-I	H	СН	(СН ₃) СН ₂ SСН ₃	H	S	5-Me-2-i	$^{-C}3^{F}7$
Q9	9-25	3-I	H	СН	(СН ₃) СН ₂ SOCН ₃	H	S	5-Me-2-i	-C ₃ F ₇
Q9	9-26	3-I	H	СН	(СН ₃) СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	S	5-Me-2-i	-c ₃ F ₇
Q9	9-27	3-I	H	C(СН ₃) ₂ СН ₂ SCH ₃	H	S	5-Me-2-i	-c ₃ F ₇
Q9	9-28	3-I	H	C(СН ₃) ₂ СН ₂ SOCH ₃	H	S	5-Me-2-i	-c ₃ F ₇
Q9	9-29	3-I	H	C(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	S	5-Me-2-i	-c ₃ F ₇
Q9	9-30	3-I	H	CH	(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	S	5-Me-2-i	^{−C} 3 ^F 7
Q9	9-31	3-I	H	C(СН ₃) ₂ СН ₂ NНAс	H	S	5-Me-2-i	−c ₃ F ₇
Q9	9-32	3-I	Et		Et	H	0	H	
Q9	9-33	3-I	Et		Et	H	0	5-Me-2-C	$2^{\mathrm{F}}5$
Q9	9-34	3-I	Et		Et	H	0	5-Me-2-n	$-c_3^F_7$
Q9	9-35	3-I	Et		Et	H	0	5-Me-2-i	-c ₃ F ₇
Q9	9-36	3-I	Et		Et	H	0	2-C1	
Q9	9-37	3-I	Et		Et	H	0	2-Br	
Q9	9-38	3-I	Et		Et	H	0	$2-n-C_3F_7$	
Q9	9-39	3-CI	3	H	i-Pr	H	NMe	5-Me-2-C	2 ^F 5
Q9	9-40	3-Pl	n	H	i-Pr	H		5-Me-2-n	
Q9	9-41	3-S(OCF ₃	H	i-Pr	H	NMe	5-Me-2-i	-c ₃ F ₇
	9-42		-			Ħ		5-Me-2-C	
Q9	9-43	3-I-	-4-C1	<u> </u>	H i-Pr	_H_	NMe	5-Ме-2-п	-C ₂ F ₇

【0065】 第4表 (続き)

Q	No.	Χn	R ¹	R ²	R ³	W	Ym	mp(℃)
Q 9	9-44	3-I-4-CF ₃	Н	i-Pr	Н	S	5-Me-2-i-C ₃ F ₇	
9	9-45	3-CF ₃ -4-C1	H	i-Pr	H	S	$5\text{-Me-}2\text{-C}_2\text{F}_5$	
) 9	9-46	3-0CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	5 -Me- 2 - n - C_3 F_7	
9	9-47	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	5 -Me- 2 - i - C_3 F $_7$	
10	10-1	3-C1	H	i-Pr	H	0	H	
10	10-2	3-C1	H	i-Pr	H	0	$4\text{-Me-}2\text{-C}_2F_5$	
10	10-3	3-C1	H	i-Pr	H	0	2,4-Br ₂	
10	10-4	3-C1	H	i-Pr	H	0	2-Ph	
10	10-5	3-Br	H	i-Pr	H	0	4 –Ne -2 –n– $\mathrm{C_3F_7}$	
10	10-6	$3-NO_2$	H	i-Pr	H	0	4 -Me- 2 - i - C_3 F $_7$	
10	10-7	3-I	H	i-Pr	H	S	4- Me	230
10	10-8	3-I	H	i-Pr	H	0	4 –Me- 2 – CF_3	
10	10-9	3-I	H	i-Pr	H	S	H	
10	10-10	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me	
10	10-11	3-I	H	i-Pr	H	S	2-C1	
10	10-12	3-I	H	i-Pr	H	S	$^{2-c}2^{F_5}$	
10	10-13	3-I	H	i-Pr	H	S	$^{2-n-C}3^{F}7$	
10	10-14	3-I	H	i-Pr	H	S	$^{2-i-c}3^{F}7$	
10	10-15	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-2-t-Bu	
10	10-16	3-I	H	i-Pr	H	S	4-Me-2-I	•
10	10-17	3-I	H	i-Pr	H	S	$4\text{-Me-}2\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q10	10-18	3-I					4 -Me- 2 -n- C_3 F $_7$	-
10	10-19	3-I	H	i-Pr	H	S	$4-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	

【0066】 第4表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	W	Ym	mb (℃)
Q10	10-20	6-I	H	i-Pr	Н	s	4-Me	198
Q10	10-21	3-I	H	t-Bu	H	NMe	2-i-C ₃ I	7
Q10	10-22	3-I	H	t-Bu	H	NMe	2-C ₂ F ₅	
Q10	10-23	3-I	H	t-Bu	H	NMe	2-n-C ₃ I	7
Q10	10-24	3-I	H	t-Bu	H	NMe	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-25	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SCH ₃	H	S	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-26	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SOCН ₃	H	S	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-27	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	S	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-28	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	S	4-Me-2-	-i-C ₃ F ₇
Q10	10-29	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SOСН ₃	H	S	4-Ne-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-30	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	S	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-31	3-I	H	СН (СН _З) СН ₂ NНАс	H	S	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-32	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	S	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-33	3-I	Et	Et	H	0	H	
Q10	10-34	3-I	Et	Et	H	0	4-Me-2-	-C ₂ F ₅
Q10	10-35	3-I	Et	Et	H	0	4-Me-2-	-n-C ₃ F ₇
Q10	10-36	3-I	Et	Et	H	0	4-Me-2-	-i-c ₃ F ₇
Q10	10-37	3-I	Et	Et	H	0	2-C1	
Q10	10-38	3-I	Et	Et	H	0	2-Br	
Q10	10-39	3-I	Et	Et	H	0	2-n-C ₃ 1	⁷ 7
Q10	10-40	3-CF	3 H	i-Pr	H	NMe	4-Me-2-	-C ₂ F ₅
Q10	10-41	3-Ph	1	H i-Pr	H	NMe	4-Me-2-	-n-C ₃ F ₇
Q10	10-42	3-S0	CF ₂	H i-Pr	H	NMe	4-Me-2-	-i-C ₂ F ₇

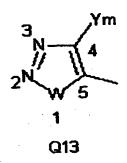
[0067]

第4表(続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R ³	W	Ym	mp(℃)
Q10	10-43	3-C ₂ F ₅	H	i-Pr	H	NMe	4-Me-2-C ₂ F ₅	
Q10	10-44	3-I-4-C1	H	i-Pr	H	NMe	$4-Me-2-n-C_3F_7$	
Q10	10-45	3-I-4-CF ₃	H	i-Pr	H	S	4 -Me- 2 - i - C_3 F_7	
Q10	10-46	3-CF ₃ -4-C1	H	i-Pr	H.	S	$4\text{-Me-}2\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q10	10-47	3-0CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	$4-Me-2-n-C_3F_7$	
Q10	10-48	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	H	i–Pr	H	S	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	

[0068]

【化23】



【0069】 第5表 (Z¹=Z²=0)

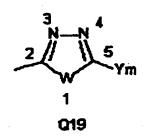
Q	No.	Χn	R ¹	R^2	R ³	W	Ym	mp(℃)
Q13	13- 1	3-C1	H	i-Pr	H	S	4-Ne	
Q13	13- 2	3-C1	H	i-Pr	H	0	4-Ne	
Q13	13- 3	3-C1	H	i-Pr	H	NMe	4-Me	
Q13	13- 4	3-I	H	i-Pr	H	S	H	
Q13	13- 5	3-I	Н	i-Pr	H	S	4-Me	60
Q13	13- 6	3-I	H	i-Pr	H	S	4-C1	
Q13	3 13- 7	3-I	H	i-Pr	H	S	4-CF ₃	
Q13	13- 8	3-I	H	i–Pr	H	S	$4-C_2F_5$	
Q13	13- 9	3-I	H	i-Pr	H	S	$4-n-C_3F_7$	
Q13	13-10	3-I	H	i-Pr	H	S	$4-i-C_3F_7$	
Q13	13-11	3-I	H	i-Pr	H	S	4-t-Bu	
Q13	3 13-12	6-I	H	i–Pr	H	S	4-Me	73
Q13	3 13-13	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH_3})\mathrm{CH_2}\mathrm{SCH_3}$	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-14	3-I	H.	$\mathtt{CH}(\mathtt{CH}_3)\mathtt{CH}_2\mathtt{SOCH}_3$	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-15	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH_3})\mathrm{CH_2}\mathrm{SO_2}\mathrm{CH_3}$	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-16	3-I	H	$\mathrm{C}(\mathrm{CH_3})_2\mathrm{CH_2}\mathrm{SCH_3}$	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-17	3-I	H	${\tt C(CH_3)}_2{\tt CH}_2{\tt SOCH}_3$	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-18	3-I	H	${\tt C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3}$	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-19	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-20	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-21	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	S	4-CF ₃	
Q13	3 13-22	3-I	H	С (СН ₃) 2СН2СН2ОСН3	H	S	4-CF ₃	
Q13	13-23	_3-I	Et	Et	H	S	H	

【0070】 第5表 (続き)

Q	No.	Xn	R^1	R^2	R^3	W	Ym	mp(℃)
Q13	13-24	3-I		Et	Н	s	4-CF ₃	
Q13	13-25	3-I	Et	Et	H	S	4-CF ₃	
Q13	13-26	3-I	Et	Et	H	S	4-CF ₃	
Q13	13-27	3-I	Et	Et	Н	S	4-CF ₃	
Q13	13-28	3-CF ₃	H	i-Pr	H	S	3-C ₂ F ₅	
Q13	13-29	3-Ph	H	i-Pr	H	S	3-n-C ₃ F ₇	
Q13	13-30	3-S0CF ₃	H	i-Pr	H	S	3-i-C ₃ F ₇	
Q13	13-31	3-C ₂ F ₅	H	i-Pr	H	S	3-C ₂ F ₅	
Q13	13-32	3-I-4-C1	H	i-Pr	H	S	^{3-n-C} 3 ^F 7	
Q13	13-33	3-I-4-CF ₃	H	i-Pr	H	S	$3-i-C_3F_7$	
Q13	13-34	3-CF ₃ -4-C1	H	i-Pr	H	S	3-C ₂ F ₅	
Q13	13-35	3-0CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	^{3-n-C} 3 ^F 7	
Q13	13-36	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	S	3-i-C ₃ F ₇	

[0071]

【化24】



【0072】 第6表 (Z¹=Z²=0)

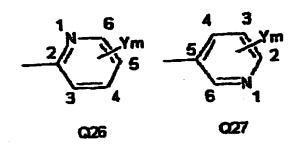
Q	No.	Χn	R ¹	R ²	R ³	W	Ym	mp(℃)
Q19	19- 1	3-C1	Н	i-Pr	H	0	H	
Q19	19- 2	3-C1	H	i-Pr	H	0	5-C ₂ F ₅	
Q19	19- 3	3-C1	H	i-Pr	H	S	5-Me	166
Q19	19- 4	3-Br	H	i-Pr	H	0	5-n-C ₃	F ₇
Q19	19- 5	3-N0 ₂	H	i-Pr	H	0	5-i-C ₃	F ₇
Q19	19- 6	3-I	H	i-Pr	H	S	H	
Q19	19- 7	3-I	H	i-Pr	H	S	5- N e	
Q19	19-8	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C1	
Q19	19- 9	3-I	H	i-Pr	H	S	5-CF ₃	104
Q19	19-10	3-I	H	i-Pr	H	S	5-C ₂ F ₅	
Q19	19-11	3-I	H	i-Pr	H	S	5-n-C ₃	F ₇
Q19	19-12	3-I	H	i-Pr	H	S	5-i-C ₃	
Q19	19–13	3-I	H	i-Pr	H	S	5-t-Bu	l
Q19	19-14	6-I	H	i-Pr	H	S	5-CF ₃	176
Q19	19–15	3-I	H	t-Bu	H	NMe	5-i-C ₃	F ₇
Q19	19–16	3-I	H	t-Bu	H		5-C ₂ F ₅	
Q19	19-17	3-I	H	t-Bu	H		5-n-C ₃	
Q19	3 19–18	3-I	H	t-Bu	H	NMe	5-CF ₃	
Q19	3 19–19	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	S	5-i-C ₃	F ₇
Q19	19-20	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SOCH ₃	H	S	5-i-C ₃	·
Q19	19–21	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SO ₂ CH ₃			5-i-C ₃	-
Q19	19-22	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H		5-i-C ₃	
Q19	19-23	_3-I	H	_C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	<u>H</u> _	S	_	•

【0073】 第6表(続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	W	Ym	mp(℃)
Q19	19–24	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	Н	S	5-i <i>-</i> C ₃ I	7
Q19	19–25	3-I	H .	CH(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	S	5-i-C ₃ I	7
Q19	19-26	3-I	H	C(CH3)2CH2NHAc	H	S	5-i-C ₃ I	7
Q19	19-27	3-I	H	сн (сн ₃) сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	S	5-i-C ₃ I	7
Q19	19-28	3-I	H	С(СН3)2СН2СН2ОСН3	H	S	5-i-C ₃ I	7
Q19	19-29	3-I	Et	Et	H	0	H	
Q19	19-30	3-I	Et	Et	H	0	5-C ₂ F ₅	
Q19	19-31	3-I	Et	Et	H	0	5-n-C ₃ I	· 7
Q19	19-32	3-I	Et	Et	H	0	5-i-C ₃ I	7
Q19	19–33	3-I	Et	Et	H	0	5-C1	•
Q19	19-34	3-I	Et	Et	H	S	5-t-Bu	59
Q19	19-35	3-CF ₃	Ħ	i-Pr	H	NMe	5-C ₂ F ₅	
Q19	19-36	3-Ph	H	i-Pr	H	NMe	5- n- C ₃ l	· 7
Q19	9 19-37	3-S0CF	3 F	i-Pr	H	NMe	5-i-C ₃ l	7
Q19	9 19–38	3-C ₂ F ₅	, F	i-Pr	H	NMe	5-C ₂ F ₅	
Q19	9 19–39	3-I-4-	-C1	∐ i−Pr	H	NMe	5-n-C ₃ 1	F7
Q19	9 19-40	3-I - 4-	-CF ₃	∐ i−Pr	Н.	S	5-i-C ₃ !	F 7
Q19	9 19-41	3-CF ₃ -	- 4 -C	H i-Pr	H	S	5-C ₂ F ₅	
Q19	9 19-42	3-0CF ₂	0-4	H i-Pr	H	S	5-n-C ₃	F 7
Q19	9 19-43	3-0CF ₂	CF ₂ C)-4 H i-Pr	H	S	5-i-C ₃	F 7

[0074]

【化25】



第7表 $(Z^1 = Z^2 = 0)$

Q	No.	Χn	R ¹	R ²	R ³	Ym	mp(℃)
Q26	26- 1	H	Н	i-Pr	Н	3-C1-5-CF ₃	85
Q26	26- 2	3-C1	H	i-Pr	H	H	
Q26	26- 3	3-C1	H	i-Pr	H	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q26	26- 4	3-Br	H	i-Pr	H	$3-Me-5-n-C_3F_7$	
Q26	26- 5	3-NO ₂	H	i-Pr	H	$3-Me-5-i-C_3F_7$	
Q26	26- 6	3-I	H	i-Pr	H	5- C ₂ F ₅	
Q26	26- 7	3-I	H	i-Pr	H	5-n-C ₃ F ₇	
Q26	26- 8	3-I	H	i-Pr	H	$^{5-i-c}3^{F}7$	
Q26	26- 9	3-I	H	i-Pr	H	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q26	26-10	3-I	H	i-Pr	H	$3-Me-5-n-C_3F_7$	
Q26	26-11	3-I	H	i-Pr	H	$3\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	140
Q26	26-12	3-I	H	i-Pr	H	$3\text{-Me-}4\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q26	26-13	3-I	H	i-Pr	H	$3-\text{Me}-4-\text{n-C}_3\text{F}_7$	
Q26	26-14	3-I	H	i-Pr	H	$3-\text{Me}-4-i-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q26	26-15	3-I	H	t-Bu	H	$^{5-i-c}3^{F}7$	
Q26.	26-16	_3-I	_H_	t-Bu	_H_	_5-C ₂ F ₅	

【0075】 第7表 (続き)

Q	No.	χn	R^1	R^2	R^3	Ym	mp(℃)
Q26	26-17	3-I	Н	t-Bu	Н	5-n-C ₃ F ₇	
Q 26	26-18	3-I	H	t-Bu	H	3-Me-5-i-C ₃ F	7
Q26	26-19	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SCH ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ F	7
Q26	26-20	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SOCH ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ F	· 7
Q26	26-21	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ F	7
Q26	26-22	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ F	7
Q26	26-23	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SOCH ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ F	7
Q26	26-24	3-I	H	$C(CH_3)_2CH_2S0_2CH_3$	H	3-Me-5-i-C ₃ F	· 7
Q26	26-25	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	3-Me-5-i-C ₃ I	7
Q 26	26-26	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	3-Me-5-i-C ₃ F	7
Q26	26-27	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ I	² 7
Q26	26-28	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	3-Me-5-i-C ₃ I	⁷ 7
Q26	26-29	3-I	Et	Et	H	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2F_5$	ペーストキ
Q26	26-30	3-I	Et	Et	H	3-Me-5-n-C ₃ I	F ₇ ペーストも
Q26	26-31	3-I	Et	Et	H	3-Me-5-i-C ₃ l	F ₇ 159
Q26	26-32	3-I	Et	Et	H	5-C1	127
Q 26	26-33	3-I	Et	Et	H	5-Br	154
Q26	26-34	3-CF ₃	H	i-Pr	H	$3-Me-5-C_2F_5$	
Q 26	26-35	3-Ph	H	i-Pr	H	3-Me-5-n-C ₃ l	F ₇
Q26	26-36	3-SOCE	3 H	i-Pr	H	3-Me-5-i-C ₃ l	F ₇
Q26	26-37	3-C ₂ F ₅	i	H i-Pr	H	$3\text{-Me-}5\text{-}\text{C}_2\text{F}_5$	
Q26	26-38	3-I-4-	-C1	H i-Pr	H	3-Me-5-n-C ₃ l	F ₇
026	26-39	3-I-4	L-CF	3 H i-Pr	H	3-Me-5-i-C ₃ 1	F _G

【0076】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	\mathbb{R}^2	R^3	Ym	$\mathtt{mp}(\mathbb{C})$
Q26	26-40	3-CF ₃ -4-C1	H	i-Pr	Н	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q26	26-41	3-0CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	$3-Me-5-n-C_3F_7$	
Q26	26-42	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	H	i–Pr	H	3-Me-5-i-C ₃ F ₇	
Q26	26-43	3-I	H	i-Pr	H	$3-Me-5-i-C_3F_7$	140
227	27- 1	Н	H	i-Pr	H	H	139
27	27- 2	Н	H	i-Pr	H	2-Me	
27	27- 3	H	H	i-Pr	H	3-Me	
27	27- 4	Н	H	i-Pr	H	4-Me	
27	27- 5	Н	Н	i-Pr	H	6-Me	
27	27- 6	H	H	i-Pr	H	2-C1	
27	27- 7	H	H	i-Pr	H	3-C1	
27	27- 8	Н	H	i-Pr	H	4-C1	
27	27- 9	H	H	i-Pr	H	6-C1	
27	27-10	3-C1	H	i-Pr	H	2-CF ₃	
27	27-11	3-C1	H	i-Pr	H	3-CF ₃	
27	27-12	3-01	H	i-Pr	H	4-CF ₃	
27	27-13	3-01	H	i-Pr	H	6-CF ₃	
)27	27-14	3-C1	H	i-Pr	H	2-NO ₂	
27	27-15	3-C1	H	i-Pr	H	3-NO ₂	
27	27-16	3-C1	H	i-Pr	H	4-NO ₂	
27	27-17	3-C1	H	i-Pr	H	6-NO ₂	
Q27	27-18	3-C1	H	i-Pr	H	2-Et	
27	27-19	3-C1	H	i-Pr	H	2-i-Pr	

【0077】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R ³	Ym	mp(℃)
Q27	27-20	3-C1	Н	i-Pr	Н	2-t-Bu	
Q27	27-21	3-C1	H	i-Pr	H	2-SCH ₃	
Q27	27-22	3-C1	H	i-Pr	H	2-SOCH ₃	
Q27	27-23	3-C1	H	i-Pr	H	2-SO ₂ CH ₃	
Q27	27-24	3-C1	H	i-Pr	H	2-SCF ₃	
Q27	27-25	3-C1	H	i-Pr	H	2-SCHF ₂	
Q27	27-26	3-C1	H	i-Pr	Н	2-COCH ₃	
Q27	27-27	3-C1	H	i-Pr	H	2-CN	
Q27	27-28	3-C1	H	i-Pr	Н	2-0CH ₃	
Q27	27-29	3-C1	H	i-Pr	H	2-0-(4-Br-Ph)	101
Q27	27-30	3-C1	H	i-Pr	H	2-0-(2,4-Cl ₂ -Ph)	97
Q27	27-31	3-C1	H	i-Pr	H	4-S-i-Pr	193
Q27	27-32	3-C1	H	i-Pr	H	4-S-i-Bu	183
Q27	27-33	3-C1	H	i-Pr	H	2-0CF ₂ CCl ₂ F	
Q27	27-34	3-C1	H	i-Pr	H	2-0CH ₂ CF ₃	
Q27	27-35	3-C1	H	i-Pr	H	2-0CH ₂ CF ₂ CHF ₂	
Q27	27-36	3-C1	H	i-Pr	H	2-cfcf ₃	•
Q27	27-37	3-C1	H	i-Pr	H	2-C00 ₂ CH(CF ₃) ₂	
Q27	27-38	3-C1	H	i-Pr	H	2-Ph	
Q27	27-39	3-C1	H	n-Bu	H	2-C1	
Q27	27-40	3-C1	H	i–Bu	. H	2-C1	
Q27	27-41	3-C1	H	s-Bu	H	2-C1	
Q27	27-42	3-C1	Н	t-Bu	H	2-C1	

【0078】 第7表 (続き)

Q	No.	χn	R^1	R^2	R ³	Ym	mp (℃)
Q27	27-43	3-C1	Н	с-С ₃ Н ₅	Н	2-C1	
Q27	27-44	3-C1	. Н	с-С ₃ Н ₅ с-С ₄ Н ₇	H	2-C1	
Q27	27-45	3-C1	H	$^{\mathrm{c-C}_5\mathrm{H}_9}$	H	2-C1	
Q27	27-46	3-C1	H	$^{\mathrm{c-C}}6^{\mathrm{H}}11}$	H	2-C1	
Q27	27-47	3-C1	H	$\mathrm{CH}_2\mathrm{CH} = \mathrm{CH}_2$	H	2-C1	
Q27	27-48	3-C1	H	CH ₂ C≡CH	H	2-C1	
Q27	27-49	3-C1	H	CH ₂ Ph	H	2-C1	
Q27	27-50	3-C1	H	C(CH ₃) ₂ C≡CH	H	2-C1	
Q27	27-51	3-C1	H	C(CH ₃) ₂ C≡CPh	H	2-C1	•
Q27	27-52	3-C1	H	$\mathrm{CH_2CH_2OCH_3}$	H	2-C1	
Q27	27-53	3-C1	H	СН ₂ СН ₂ ОРЬ	H	2-C1	
Q27	27-54	3-C1	H	CH ₂ CH ₂ NHPh	H	2-C1	
Q27	27-55	3-C1	H	$\mathrm{CH_2CH_2OCH_3}$	H	2-C1	
Q27	27-56	3-C1	H	$\mathrm{CH_2CH_2CO_2CH_3}$	H	2-C1	
Q27	27-57	3-C1	H	Сн ₂ сн ₂ соинсн ₃	H	2-C1	
Q27	27-58	3-C1	Et	Et	H	2-C1	
Q27	27-59	3-C1	n-Pr	n-Pr	. H .	2-C1	
Q27	27-60	3-C1	i-Pr	i-Pr	H	2-C1	
Q27	27-61	3-C1	i-Pr	Ме	H	2-C1	
Q27	27-62	3-C1	i-Bu	Ме	H	2-C1	
Q27	27-63	3-C1	CH ₂ CH=CH ₂	СH ₂ CH=CH ₂	H	2-C1	
Q27	27-64	3-C1	Et	Et	Мe	2-C1	
Q27	27-65	3-C1	n-Pr	i-Pr	Мe	2-C1	

【0079】 第7表 (続き)

ð	No.	Χn	R^1	R ²	R^3	Ym	mb(℃)
27	27-66	3-C1	i-Pr	i-Pr	Ме	2-C1	
27	27-67	3-C1	Et	Et	Ac	2-C1	
27	27-68	3-C1	n-Pr	i-Pr	Ac	2-C1	
27	27-69	3-C1	i-Pr	i-Pr	Ac	2-C1	
27	27-70	3-C1	-(CH ₂) ₄	<u>-</u> -	H	2-C1	
27	27-71	3-C1	-(CH ₂) ₂ 0(C	CH ₂) ₂ -	H	2-C1	
27	27-72	3-C1	i–Pr	SO ₂ CH ₃	H	2-C1	
27	27-73	3-C1	i-Pr	CN	H	2-C1	
27	27-74	3-C1	i-Pr	со ₂ сн ₃	H	2-C1	
27	27-75	3-C1	i-Pr	COCH ₃	H	2-C1	
27	27-76	3-C1	i-Pr	COPh	H	2-C1	
27	27-77	3-C1	i-Pr	NHCOCH ₃	. Н	2-C1	
27	27-78	3-C1	H	i-Pr	Н	2,4-Me ₂	
27	27-79	3-C1	H	i-Pr	H	2,4-Cl ₂	
27	27-80	3-C1	H	i-Pr	• Н	4,6-Me ₂	•
27	27-81	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-C1	211
27	27-82	3-C1	H .	i-Pr	H	4-Me-2-F	
<u>)</u> 27	27-83	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-Br	
27	27-84	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-I	
27	27-85	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-OCH	F_2
27	27-86	3-C1	H	iPr	H	4-Me-2-0CF	3
27	27-87	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-NO ₂	
27	27-88	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-NMe	o

【0080】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	Ym	mp(℃)
Q27	27-89	3-C1	Н	i-Pr	Н	4-Me-2-C≡CH	
Q27	27-90	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-C≡C-t-Bu	
Q27	27-91	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-C≡CPh	
Q27	27-92	3-C1	H	i-Pr	Ħ	4-Me-2-CF ₂ CF ₃	
Q27	27-93	3-C1	H	i-Pr	H	$^{4\text{-Me-}2\text{-}i\text{-}C_3F_7}$	
Q27	27-94	3-C1	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-n-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-95	3-C1	H	i-Pr	H	${\tt 4-Me-2-OCH}_2{\tt OCH}_3$	
Q27	27-96	3-C1	H	i-Pr	H	${\tt 4-Me-}2{\tt -OCF}_2{\tt CHF}_2$	
Q27	27-97	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-0Ph	
Q27	27-98	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-0-(4-Br-Ph)	79
Q27	27-99	3-C1	H	i-Pr	H	$4-Me-2-OSO_2Ph$	
Q27	27-100	3-C1	H	i-Pr	H	${\tt 4-Me-2-OCH}_2{\tt CO}_2{\tt CH}_3$	
Q27	27-101	3-C1	H	i-Pr	H	${\tt 4-Me-2-CO_2CH_3}$	
Q27	27-102	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-S-i-Pr	
Q27	27-103	3-C1	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{SCHF}_2$	
Q27	27-104	3-C1	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{SOCHF}_2$	
Q27	27-105	3-C1	H	i-Pr	H	${\tt 4-Ne-2-SO_2CHF}_2$	
Q27	27-106	3-C1	H	i-Pr	H	4-C1-2-CF ₃	
Q27	27-107	3-C1	H	i-Pr	H	4-C1-2-OCF ₃	
Q27	27-108	3-C1	H	i-Pr	H	4-C1-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-109	3-C1	H	i-Pr	H	4-C1-2-CF ₃	
Q27	27-110	3-C1	H	i-Pr	H	4-C1-2-OCHF ₂	
Q27	27-111	3-C1	H	i-Pr	H	4-C1-2-0S0 ₂ Ph	

【0081】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	Ym	mp(℃)	
Q27	27-112	3-C1	H	i-Pr	Н	4-0СН ₃ -2-Рh		
Q27	27-113	3-C1	H	i-Pr	H	4-CF ₃ -2-C1		
Q27	27-114	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-3-CF ₃		
Q27	27-115	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-3-C1		
Q27	27-116	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-3-OCF ₃		•
Q27	27-117	3-C1	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}3\text{-}\mathrm{CF}_2\mathrm{CF}_3$	·	
Q27	27-118	3-C1	H	i-Pr	H	4 -Ne- 3 - n - C_3 F_7		
Q27	27-119	3-C1	H	i-Pr	H	$^{4-\texttt{Ne}-3-\texttt{i}-\texttt{C}_3\texttt{F}_7}$.*	
Q27	27-120	3-C1	H	i-Pr	H	3,4-Me ₂ -2-Cl		
Q27	27-121	3-C1	H	i-Pr	H	3,4-Me ₂ -2-OMe		
Q27	27-122	3-C1	H	i-Pr	H	3,4-Me ₂ -2-SMe		•
Q27	27-123	3-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2,3-Cl ₂		
Q27	27-124	6-C1	H	i-Pr	H	2-0-(4-Br-Ph)	170	
Q27	27-125	6-C1	H	i-Pr	H	2-0-(2,4-Cl ₂ -Ph)	189	
Q27	27-126	6-C1	H	i-Pr	H	2-S-i-Pr	120	
Q27	27-127	6-C1	H	i-Pr	H	2-S-i-Bu	187	
Q27	27-128	6-C1	H	i-Pr	H	4-Me-2-C1	230	
Q27	27-129	3-I	Et	Et	H	$6-C1-2-n-C_3F_7$	122	
Q27	27-130	3-I	Et	Et	H	2-C1	203	
Q27	27-131	3-I	Et	Et	H	$2-n-C_3F_7$	200	
Q27	27-132	3-I	Et	Et	H.	2-0-(4-Br-Ph)	247	
Q27	27-133	3-I	H	i-Pr	H	2-C1	215	
Q27	27-134	3-I	H	i-Pr	H	2-C ₂ F ₅	不定形固体	

【0082】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R ²	R ³ Y	m	mp(℃)
Q27	27-135	3-I	H	i-Pr	Н	2-n-C ₃ F ₇	200
Q27	27-136	3-I	H	i–Pr	H	$2-i-C_3F_7$	270
Q27	27-137	3-I	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	257
Q27	27-138	3-I	H	i-Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	234
Q27	27-139	3-I	H	t-Bu	H	$2-i-C_3F_7$	275
Q27	27-140	3-I	H	t-Bu	H	$^{2-C}2^{F}5$	260
Q27	27-141	3-I	H	t-Bu	H	$2-n-C_3F_7$	245
Q27	27-142	3-I	H	t-Bu	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	250
Q27	27-143	3-I	H	t-Bu	H	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	246
Q27	27-144	3-I	H	СН (СН ₃)СН ₂ SCH ₃	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	225
Q27	27-145	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SСН ₃	Н	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	229
Q27	27-146	3 –I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SOCH ₃	H	4 -Me- 2 -i- C_3 F $_7$	
Q27	27-147	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SOCH ₃	Н	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	
Q27	27-148	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ CH ₃	3 H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	•
Q27	27-149	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ CH ₃	3 H	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	
Q27	27-150	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SСН ₃	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	173
Q27	27-151	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SСН ₃	H	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	213
Q27	27-152	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	H	4 -Me- 2 - i - C_3 F_7	
Q27	27-153	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	H	6-Me-2-i-C ₃ F ₇	アモルファ
Q27	27-154	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	3 H	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	• .
Q27	27-155	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	3 H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-156	3-I	H	CH (CH ₃)CH ₂ NHAc	Н	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-157	3-I	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHAc	H	6-Me-2-i-C ₂ F ₂	

【0083】 第7表 (続き)

Q 	No.	Хn	R ¹	R ²	R ³	Ym	mp(℃)
Q27	27-158	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	Н	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-159	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	$6-Me-2-i-C_3F_7$	
Q27	27-160	3-I	H	сн (сн ₃) сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	
)27	27-161	3-I	H	сн (сн ₃) сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
⊋27	27-162	3-I	H	С (СН ₃) 2 СН2 СН2 ОСН3	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	
)27	27-163	3-I	H	с (сн ₃) ₂ сн ₂ сн ₂ осн ₃	H	$6-Me-2-i-C_3F_7$	
227	27-164	3-NO ₂	H	i-Pr	H	H	209
)27	27-165	3-NO ₂	H	i-Pr	H	4-Me-2-CF ₂ CF ₃	
27	27-166	3-NO ₂	H	i–Pr	H	4-Me-2-n-C ₃ F ₇	
Q27	27-167	3-NO ₂	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-i-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-168	3-NO ₂	H	i–Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
Q27	27-169	3-NO ₂	H	i-Pr	H	$6-Me-2-n-C_3F_7$	
)27	27-170	3-NO ₂	H	i–Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	
Q27	27-171	3-NO ₂	H	i–Pr	H	4-Me-2-C1	
Q27	27-172	3-CN	H	i–Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
Q27	27-173	3-CN	H	i–Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{n}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-174	3-CN	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-175	3-CN	H	i-Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
Q27	27-176	3-CN	H	i-Pr	H	6-Me-2-n-C ₃ F ₇	
Q27	27-177	3-CN	H	i-Pr	H	$6-Me-2-i-C_3F_7$	
Q27	27-178	3-CN	H	i-Pr	H	4-Me-2-C1	
Q27	27-179	3-CF ₃	Н	i-Pr	H	4-Me-2-CF ₂ CF ₃	,
Q27	27-180	3-CF ₂	Н	i–Pr	H	6-Me-2-n-C ₃ F ₇	,



【0084】 第7表 (続き)

Q	No.	Xn	R^1	R^2	R^3	Ym	mp(℃)
 Q27	27-181	3-0CH ₃	Н	i-Pr	H	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-182	3-0CH ₃	H	i-Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
Q27	27-183	3-0CF ₃	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-n-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-184	3-0CF ₃	H	i-Pr	H	$^{6\text{-Me-}2\text{-}i\text{-}C}3^{F}7$	
Q27	27-185	3-SCH ₃	H	i-Pr	H	${\small 4\text{-}Ne\text{-}2\text{-}CF}_{2}\text{CF}_{3}$	
Q27	27-186	3-SCH ₃	H	i-Pr	H	$^{6-\texttt{Me}-2-\texttt{n}-\texttt{C}}3^{\texttt{F}}7$	
Q27	27-187	3-S-i-Pr	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-188	3-S-i-Pr	H	i–Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{CF}_2\text{CF}_3$	
Q27	27-189	3-SOCH ₃	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-n-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-190	3-SOCH ₃	H	i-Pr	H	$^{6\text{-Me-}2\text{-}i\text{-}C_3F_7}$	
Q27	27-191	$3-S0_2$ CH $_3$	H	i-Pr	H	${\tt 4-Me-2-CF}_2{\tt CF}_3$	
Q27	7 27-192	3-SO ₂ CH ₃	H	i-Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{n-C}_3\text{F}_7$	
Q27	7 27-193	$3-SCH_2CF_3$	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	
Q27	7 27-194	3-SCF ₃	H	i-Pr	H	4 -Me- 2 - $\mathrm{CF_2}\mathrm{CF_3}$	
Q27	7 27-195	3-S0CF ₃	H	i-Pr	H	4 -Me- 2 - n - C_3 F_7	
Q27	7 27-196	3-S0 ₂ CF ₃	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	7 27-197	3-SPh	H	i–Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
Q27	7 27-198	3-S0Ph	H	i-Pr	H	$6\text{-Me-}2\text{-n-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	7 27-199	3-S0 ₂ Ph	H	i–Pr	H	$6-Me-2-i-C_3F_7$	
Q2'	7 27-200	3-0Ph	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-CF}_2\text{CF}_3$	
Q2′	7 27-201	3-Ph	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	
Q2'	7 27-202	3-C≡CH	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}C_3F_7$	
Q2:	7_27-203	3-C≡C-t-Bu	H	i-Pr	H	4-Me-2-i-C ₂ F ₇	

【0085】 第7表 (続き)

Q	No.	Xn	R^1	\mathbb{R}^2	R^3	Ym	mp(℃)
Q27	27-204	3-C≡CPh	Н	i-Pr	Н	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-205	3-C ₂ F ₅	H	i-Pr	H	$4-\texttt{Me}-2-\texttt{i}-\texttt{C}_3\texttt{F}_7$	
Q27	27-206	3-со ₂ сн ₃	H	i-Pr	H	$6-Me-2-i-C_3F_7$	
Q27	27-207	3-CONHCH3	H	i-Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-208	3-COCH ₃	H	i-Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-209	3-CCH ₃ (=NOCH ₃)	H	i-Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-210	3,4-Cl ₂	H	i-Pr	H	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-211	3,6-Cl ₂	H	i-Pr	H	4-Me-2-n-C ₃ F ₇	
Q27	27-212	3,5-Cl ₂	H	i-Pr	H	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-213	3,5-Cl ₂	H	i-Pr	H	6-Me-2-CF ₂ CF ₃	
Q27	27-214	4,5-Cl ₂	H	i-Pr	H	4-Me-2-n-C ₃ F ₇	
Q27	27-215	4,5-Cl ₂	H	i-Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q27	27-216	3-I-4-Cl	H	i-Pr	H	4-Me-2-CF ₂ CF ₃	
Q27	27-217	3-I-4-F	H	i-Pr	H	4-Me-2-n-C ₃ F ₇	
Q27	27-218	3-I-4-CF ₃	H	i-Pr	H	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	
Q27	27-219	3-I-4-0CH ₃	H	i-Pr	H	4-Me-2-CF ₂ CF ₃	
Q27	27-220	3-CF ₃ -4-C1	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{n}-\text{C}_3\text{F}_7$	
		3-CF ₃ -4-0CH ₃				•	
Q27	27-222	3-0CH ₂ 0-4	H	i-Pr	H	$6-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	•
		3-0CF ₂ 0-4				•	
		3-0СН ₂ СН ₂ 0-4					
	_	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4					
		3-CH=CH-CH=CH-4					

【0086】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn		R^1 R^2	R ³	Ym	mb(℃)
Q27	27-227	3-I		H i-Pr	H	4-Me-3-CF ₂ CF ₃	
Q27	27-228	3-I		H i-Pr	H	4 -Me- 3 -i- C_3 F $_7$	
Q27	27-229	3-I	٠	H i-Pr	H	4 -Me- 3 - n - C_3 F_7	
Q27	27-230	3-I		H i-Pr	H	6-C1-2-i-C ₃ F ₇	188
Q27	27-231	3-I		Et Et	H	6-C1-2-i-C ₃ F ₇	164
Q27	27-232	3-I	H	CH(Me)CH ₂ SMc	H	6-C1-2-i-C ₃ F ₇	177
Q27	27-233	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	$2-i-C_3F_7$	229
Q27	27-234	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	∍ H	6 - $C1$ - 2 - i - C_3 F_7	175
Q27	27-235	3-I	H	C(Ne) ₂ CH ₂ SOM	e H	6 - $C1$ - 2 - i - C_3 F_7	ペースト
Q27	27-236	3-I	H	C(Me)2CH2SO2Me	e H	6 - $C1$ - 2 - i - C_3 F_7	アモルファス
Q27	27-237	3-I	H	$C(Me)_2CH_2SMe$	e H	$6-i-c_3F_7$	183
Q27	27-238	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SOM	e H	$6-i-c_3F_7$	アモルファス
Q27	27-239	3-I	H	C(Me)2CH2SO2M	e H	$6-i-C_3F_7$	アモルファス
Q27	27-240	3-I	H	$C(Me)_2CH_2SMe$	e H	4,6-Cl ₂ -2-i-C ₃ F	7 120
Q27	27-241	3-I	H	CH(Me)CH ₂ SM	е Н	$6\text{-MeO-}2\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	134
Q27	27-242	3-I	H	i-Pr	Т	$6-MeO-2-i-C_3F_7$	158
Q27	27-243	3-I	H	$C(Me)_2CH_2SM$	е Н	$6-MeO-2-i-C_3F_7$	134
Q27	27-244	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SOM	е Н	$6-MeO-2-i-C_3F_7$	アモルファス
Q27	27-245	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SM	е Н	$6\text{-MeS-2-i-C}_3\text{F}_7$	179
Q27	27-246	3-I	Н	i-Pr	H	$6\text{-MeS-}2\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	219
Q27	27-247	3-I	H	i-Pr	H	$6\text{-MeSO-}2\text{-}\mathrm{i}\text{-}\mathrm{C}_3\mathrm{F}_7$	アモルファス
Q27	27-248	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	2-OCHF ₂	198
Q27	27-249	3-I	H	C(Me)2CH2SO2M	e H	2-0CHF ₂	207

1

【0087】 第7表 (続き)

Q	No.	Χn		R^1 R^2	R^3	Ym .	mp(℃)
Q27	27-250	3-I	Н	i-Pr	H	2-0CHF ₂	205
Q27	27-251	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	2-SCHF ₂	174
Q27	27-252	3-I	H	i-Pr	H	2-SCHF ₂	226
Q27	27-253	3-I	H	i-Pr	H	2-S0 ₂ CHF ₂	230
Q27	27-254	3-I	H	i-Pr	H	6-Me-2-OCHF ₂	252
Q27	27-255	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	6-Me-2-OCHF ₂	124
Q27	27-256	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SOMe	H	6-Me-2-OCHF ₂	185
Q27	27-257	3-I	• Н	${\tt C(Ne)}_2{\tt CH}_2{\tt SO}_2{\tt Ne}$	H	6-Me-2-OCHF ₂	102
Q27	27-258	3-I	H	i-Pr	H	6-Me-2-SCHF ₂	226
Q27	27-259	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	6-Me-2-SCHF ₂	198
Q27	27-260	3-I	Н	i-Pr	H	6-Me-2-OCH(CF ₃)	266
Q27	27-261	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	6-Me-2-OCH(CF ₃)	2 223
Q27	27-262	3-I	H	i-Pr	H	6-C1-2-OCH(CF ₃)	2 216
Q27	27-263	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SMe	H	6-C1-2-OCH(CF ₃)	2 100
Q27	27-264	3-I	H	${\tt C(Me)}_2{\tt CH}_2{\tt SOMe}$	H	6-Me-2-OCH(CF ₃))2
Q27	27-265	3-I	H	${\tt C(Me)}_2{\tt CH}_2{\tt SO}_2{\tt Me}$	H	6-Me-2-OCH(CF ₃))2
Q27	27-266	3-I	H	C(Me) ₂ CH ₂ SOMe	H	6-C1-2-OCH(CF ₃))2
Q27	27-267	3-I	H	$\mathrm{C(Me)}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{SO}_2\mathrm{Me}$	H	6-C1-2-OCH(CF ₃))2
Q27	27-268	3-I	H	$C(Me)_2CH_2SMe$	H	6-0Me-2-0CH(CF	₃) ₂
Q27	27-269	3-I	H	${\tt C(Me)}_2{\tt CH}_2{\tt SMe}$	H	6-F-2-OCH (CF ₃)	2

[0088]

<u> 第7表中、物性がアモルファス又はペーストの化合物の ¹H-NMRデータを</u> 下記に示す。

特2000-080991

```
^{1}H-NMR [\delta (ppm/CDCl<sub>2</sub>)]
 No
          1.59(s.3H), 1.64(s.3H), 2.26(s.3H), 2.62(s.3H), 2.88(d.1H),
27-153
          3.02(d.1H), 6.83(br.1H), 7.23(t,1H), 7.58(dd,1H),
          7.78(d.1H), 8.00(dd.1H), 8.58(br.1H), 8.81(d.1H).
          1.64(s.3H), 1.66(s.3H), 2.40(s.3H), 2.88(d.1H), 3.24(d.1H),
27-235
          6.72(br.1H), 7.24(t.1H), 7.70(dd.1H), 7.74(d.1H),
          8.03(dd.1H), 8.85(br.1H), 9.12(d.1H).
          1.71(s.6H), 2.71(s.3H), 3.63(s.2H), 6.25(br.1H), 7.25(t.1H),
27-236
          7.70(dd.1H), 7.75(dd.1H), 8.05(dd.1H), 8.81(br.1H),
          9.11(d.1H).
          1.68(s.3H), 1.72(s.3H), 2.49(s.3H), 2.99(d.1H), 3.21(d.1H),
27-238
          6.76(br.1H), 7.21(t.1H), 7.50(dd,1H), 7.66(dd,1H),
          7.84(dd.1H), 8.37(dd,1H), 8.68(d.1H), 9.75(br.1H).
27-239
          1.80(s.6H), 2.87(s.3H), 3.73(s.2H), 6.23(br.1H), 7.23(t.1H),
          7.43(dd.1H), 7.65(dd.1H), 7.82(dd,1H), 8.35(dd,1H),
          8.64(d.1H), 9.88(br,1H).
          1.60(s.3H), 1.63(s.3H), 2.41(s.3H), 2.84(d.1H), 3.31(d.1H),
27-244
          4.02(s.1H), 6.59(br.1H), 7.21(t,1H), 7.34(dd,1H),
          7.69(dd.1H), 7.99(dd,1H), 8.65(br.1H), 8.88(d.1H).
27-247
          1.31(dd.6H), 3.50(s.3H), 4.33(m.1H), 5.60(d.1H), 7.19(t.1H),
          7.68(d.1H), 7.74(dd.1H), 8.00(d.1H), 9.26(d.1H),
          11.8(br.1H).
```



[0089]

【化26】

【0090】 第8表 (Z¹=Z²=0)

)	No.	Χn	R	1 R ²	R^3	Y m	mp(℃)
29	29-1	3-C1	H	i-Pr	Н	Н	
29	29-2	3-C1	H	i-Pr	H	4 –Me- 6 – C_2 F_5	
9	29-3	3-Br	H	i-Pr	H	4 -Me- 6 -n- C_3 F $_7$	
29	29–4	3-NO ₂	H	i–Pr	H	4 -Me- 6 - i - C_3 F_7	
9	29-5	3-I	H	i-Pr	H	H	
29	29-6	3-I	H	i-Pr	H	6-C1	136
29	29-7	3-I	H	i-Pr	H	6- C ₂ F ₅	
9	29-8	3-I	H	i-Pr	H	6-n-C ₃ F ₇	
9	29-9	3-I	H	i-Pr	H	6-i-c ₃ F ₇	
9	29-10	3-I	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}6\text{-C}_2\text{F}_5$	
29	29-11	3-I	H	i-Pr	H	4 -Me- 6 -n- C_3 F $_7$	
:9	29-12	3-I	H	i-Pr	H	4 -Me- 6 -i- C_3 F $_7$	
29	29-13	3-I	H	i-Pr	H	4-Me-5-C ₂ F ₅	
9	29-14	3-I	H	i-Pr	H	$^{4-\mathrm{Me}-5-\mathrm{n}-\mathrm{C}_3\mathrm{F}_7}$	
9	29-15	3-I	H	i- <u>P</u> r	<u>H</u>	4-Me-5-i-C ₃ F ₇	

ý

【0091】 第8表(続き)

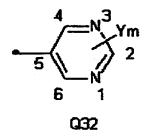
Q	No.	χn	R^1	R^2	R^3	Ym	mp(℃)
Q29	29-16	3-I	Н	t-Bu	Н	6-i-C ₃ F ₇	
Q 29	29-17	3-I	H	t-Bu	H	$6-C_2F_5$	
Q29	29-18	3-I	H	t-Bu	H	$6-n-C_3F_7$	
Q29	29-19	3-I	H	t-Bu	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-20	3-I	H	$\mathtt{CH}(\mathtt{CH}_3)\mathtt{CH}_2\mathtt{SCH}_3$	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-21	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH}_3)\mathrm{CH}_2\mathrm{SOCH}_3$	H	$^{4\text{-Me-}6\text{-}i\text{-}C_3F_7}$	
Q29	29-22	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-23	3-I	H	${\tt C(CH_3)_2CH_2SCH_3}$	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-24	3-I	H	$\mathrm{C(CH_3)_2CH_2SOCH_3}$	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-25	3-I	Н	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-26	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29–27	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29–28	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH}_3)\mathrm{CH}_2\mathrm{CH}_2\mathrm{OCH}_3$	H	$4-Me-6-i-C_3F_7$	
Q29	29-29	3-I	H	$\mathtt{C(CH_3)_2CH_2CH_2OCH_3}$	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q29	29-30	3-I	Et	Et	H	Н	
Q29	29-31	3-I	Et	Et	H	$4\text{-Me-}6\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q29	29-32	3-I	Et	Et	H	$4\text{-Me-}6\text{-n-}\text{C}_3\text{F}_7$	•
Q29	29-33	3-I	Et	Et	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q 29	29-34	3-I	Et	Et	H	6-C1	
Q29	29-35	3-I	Et	Et	H	6-Br	
Q 29	29-36	3-I	Et	Et	H	6-n-C ₃ F ₇	
Q29	29-37	3-CF ₃	H	i-Pr		$4\text{-Me-}6\text{-C}_2\text{F}_5$	
029	29-38	3-Ph	<u> </u>	i-Pr	-11-	4-Me-6-n-C ₂ F ₇ -	

【0092】 第8表 (続き)

Q	No.	Хn	R^1	R^2	R^3	Ym	m p(℃)
Q29	29-39	3-SOCF ₃	Н	i-Pr	Н	4-Me-6-i-C ₃ F ₇	
Q29	29-40	3-C ₂ F ₅	H	i–Pr	Н	$4-\text{Me}-6-\text{C}_2\text{F}_5$	
Q29	29-41	3-I-4-C1	H	i–Pr	H	4-Me-6-n-C ₃ F ₇	
Q29	29-42	3-I-4-CF ₃	H	i-Pr	Н	4-Me-6-i-C ₃ F ₇	
Q29	29-43	3-CF ₃ -4-C1	H	i–Pr	H	$4-\text{Me}-6-\text{C}_2\text{F}_5$	
Q 29	29-44	3-0CF ₂ 0-4	H	i–Pr	H	4-Me-6-n-C ₃ F ₇	
Q29	29-45	3-0CF ₂ CF ₂ 0-4	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}6\text{-i-}C_3F_7$	

[0093]

【化27】



【0094】 第9表 (Z¹=Z²=0)

Q	No.	Χn	R ¹	R^2	R ³	Ym .	mp(℃)
Q32	32- 1	3-C1	H	i-Pr	H	Н	
Q32	32- 2	3-C1	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{C}_2\text{F}_5$	
Q32	32- 3	3-Br	H	i-Pr	H	4-Ne-2-n-C ₃ F ₇	
Q32	32- 4	$3-N0_2$	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$	
Q32	32- 5	3-I	H	i-Pr	H	2- C ₂ F ₅	
Q32	32- 6	3-I	H	i-Pr	H	2-n-C ₃ F ₇	
Q32	32- 7	3-I	H	i-Pr	H	$2-i-C_3F_7$	
Q32	32- 8	3-I	H	i-Pr	H	$4\text{-Me-}2\text{-C}_2\text{F}_5$	
Q32	32- 9	3-I	H	i-Pr	H	$4-\text{Me}-2-\text{n-C}_3\text{F}_7$	
Q32	32-10	3-I	H	i-Pr	H	$^{4-\text{Me}-2-i-\text{C}}_3\text{F}_7$	
Q32	32-11	3-I	H	i-Pr	H	4,6-Cl ₂	257
Q32	32-12	3-I	H	t-Bu	H	$2-i-C_3F_7$	
)32	32-13	3-I	H	t-Bu	H	$2-C_2F_5$	
Q32	32-14	3-I	H	t-Bu	H	$2-n-C_3F_7$	
Q32	32-15	3-I	H	t-Bu	H	$^{4-\text{Me-}2-i-\text{C}}_3\text{F}_7$	
Q32	32-16	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH}_3)\mathrm{CH}_2\mathrm{SCH}_3$	H	$^{4-\mathrm{Me}-2-\mathrm{i}-\mathrm{C}_{3}\mathrm{F}_{7}}$	
Q32	32-17	3-I	H	$\mathtt{CH}(\mathtt{CH}_3)\mathtt{CH}_2\mathtt{SOCH}_3$	H	$^{4-\text{Me}-2-i-\text{C}}_3\text{F}_7$	
Q32	32-18	3-I	H	$\mathtt{CH}(\mathtt{CH}_3)\mathtt{CH}_2\mathtt{SO}_2\mathtt{CH}_3$	H	$^{4-\text{Me}-2-i-\text{C}}_3\text{F}_7$	
Q32	32-19	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SCH ₃	H	$4\text{-Me-}2\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$	
Q32	32-20	3-I	H	$\mathrm{C(CH_3)_2CH_2SOCH_3}$	H	$^{4-\text{Me}-2-i-\text{C}}_3\text{F}_7$	
Q32	32-21	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	$^{4-\text{Me}-2-\text{i}-\text{C}}_3\text{F}_7$	
Q32	32-22	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ NHAc	H	$^{4-\texttt{Me}-2-\texttt{i}-\texttt{C}_3\texttt{F}_7}$	
132	32-23	3-I	_H_	C(CH ₃) ₂ CH ₂ NHAc	<u>H</u>	4-Me-2-i-C ₃ F ₇	

【0095】 第9表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R ³	Ym	Mp(°C)
			·	 			
Q32	32-24	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	4-Me-2-i	$-c_3F_7$
Q32	32-25	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	4-Me-2-i	-c ₃ F ₇
Q32	32-26	3-I	Et	Et	H	4-Me-2-C	2^{F}_{5}
Q32	32-27	3-I	Et	Et	H	4-Me-2-n	$-C_3F_7$
Q32	32-28	3-I	Et	Et		4-Me-2-i	
Q32	32-29	3-I	Et	Et	Н	2-C1	•
Q32	32-30	3-I	Et	Et	H	2-Br	
Q32	32-31	3-I	Et	Et	H	2-n-C ₃ F ₇	
Q 32	32-32	3-CF3	H	i-Pr	H	4-Me-2-C	
Q32	32-33	3-Ph	H	i-Pr	H		
Q32	32-34	3-S0CF ₃	H	i-Pr	. Н	4-Me-2-i	
Q32	32-35	3-C ₂ F ₅	H	i-Pr	H	4-Me-2-C	٠.
Q32	32-36	20		i-Pr	H	4-Me-2-n	
Q32	32-37	3-I-4-CF ₃	Н	i-Pr	H		٠.
		3-CF ₃ -4-C1			H	4-Me-2-C	•
		3-0CF ₂ 0-4			H	4-Me-2-n	
		3-0CF ₂ CF ₂ 0-			H	4-Me-2-i	• •
•	32-41		H	CH(Me)CH ₂ SMe	H	4-Me-2-C	0.
	. 52 11		**	on (no) on 20110	11	4 HC 2 C	•



【化28】

第10表 $(Z^1=Z^2=0)$

Q	No.	Χn	I	R^1 R^2	R^3	Ym	mp(℃), nD(℃)
Q33	33- 1	Н	H	i-Pr	Н	4,6-(OM	e) ₂	61
Q33	33- 2	3-C1	H	i-Pr	H	H		
Q33	33- 3	3-C1	H	i–Pr	H	5-C ₂ F ₅		
Q33	33- 4	3-Br	H	i-Pr	H	5-n-C ₃ F ₇	7	
Q33	33- 5	3-N0 ₂	H	i-Pr	H	5-i-C ₃ F ₇	7	÷
Q33	33- 6	3-I	H	i-Pr	H	5- C ₂ F ₅		
Q33	33- 7	3-I	H	i-Pr	H	5-n-C ₃ F ₇	7	
Q33	33- 8	3-I	H	i-Pr	H	5-i-C ₃ F ₇		•
Q33	33- 9	3-I	H	i-Pr	H	4,6-0Me	nD	1.5672(20.9)
Q33	33-10	3-I	H	i-Pr	H	4,6-0Me	- 2-5-i-C ₃ F	7
							nD	1.5045(21.9)
Q33	33-11	3-I	H	t-Bu	H	5-i-C ₃ F ₇	,	
Q33	33-12	3-I	H	t-Bu	H	5-C ₂ F ₅		
Q33	33-13	3-I	H	t-Bu		5-n-C ₃ F ₇	,	
233	33-14	3-I	H	СН (СН3)СН2		٠.		
J33	33-15	3-I	H	_CH(CH ₃)CH ₂			• •	

【0097】 第10表 (続き)

Q	No.	Χn	R^1	R^2	R^3	Ym mp(℃), nD(℃)
Q33	33-16	3-I	H	СН (СН ₃)СН ₂ SO ₂ CH ₃	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-17	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SСН ₃	H	5-i- C ₃ F
Q33	33-18	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ SOСН ₃	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-19	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-20	3-I	H	CH(CH3)CH2NHAC	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-21	3-I	H	C(CH3)2CH2NHAc	Н	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-22	3-I	H	СН (СН ₃) СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-23	3-I	H	С(СН ₃) ₂ СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-24	3-I	Et	Et	H	5-C ₂ F ₅
Q33	33-25	3-I	Et	Et	H	5-n-C ₃ F ₇
Q33	33-26	3-I	Et	Et	H	5-i-C ₃ F ₇
Q33	33-27	3-I	Et	Et	H	5-C1
Q 33	33-28	3-I	Et	Et	H	5-Br
Q33	33-29	3-I	Et	Et	H	$5-n-C_3F_7$

[0098]

【化29】

【0099】 第11表 (Z¹=Z²=0)

Q 	No.	Χn	R ¹	R ²	R ³	Ym mp(°C)
Q34	34- 1	3-C1	H	i-Pr	Н	Н
Q34	34- 2	3-C1	H	i-Pr	H	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2F_5$
Q34	34- 3	3-Br	Ħ	i-Pr	H	$3-\text{Me}-5-\text{n}-\text{C}_3\text{F}_7$
Q34	34- 4	3-NO ₂	H	i-Pr	H	$3-\text{Me}-5-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$
Q34	34- 5	3-I	H	i-Pr	H	H 185
Q34	34- 6	3-I	H	i-Pr	H	5-I 198
Q34	34- 7	3-I	H	i-Pr	H	$5-c_2F_5$
Q34	34- 8	3-I	H	i-Pr	H	$5-n-C_3F_7$
Q34	34- 9	3-I	H	i-Pr	H	5-i-C ₃ F ₇
Q34	34-10	3-I	H	i-Pr	H	$3\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$
Q34	34-11	3-I	H	i-Pr	H	$3-Me-5-n-C_3F_7$
Q34	34-12	3-I	H	i-Pr	H	$^{3\text{-Me-}5\text{-}i\text{-}C}3^{F}7$
Q34	34-13	3-I	H	i-Pr	H	$6\text{-Me-}5\text{-C}_2\text{F}_5$
Q34	34-14	3-I	H	i-Pr	H	$6-Me-5-n-C_3F_7$
Q34	34-15	3-I	H	i-Pr	H	$6\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$
Q34	34-16	3-I	H	t-Bu	H	$5-i-C_3F_7$
Q34	34-17	3-I	H	t-Bu	H	$5-c_2F_5$
Q34	34-18	3-I	H	t-Bu	H	$5-n-C_3F_7$
Q34	34-19	3-I	H	t-Bu	H	$3\text{-Me-}5\text{-i-C}_3\text{F}_7$
Q34	34-20	3-I	H	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	H	$3\text{-Me-}5\text{-i-}\text{C}_3\text{F}_7$
Q34	34-21	3-I	H	$\mathrm{CH}(\mathrm{CH}_3)\mathrm{CH}_2\mathrm{SOCH}_3$	H	$3-\text{Me}-5-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$
Q34	34-22	3-I	H	$CH(CH_3)CH_2SO_2CH_3$	H	$3-\text{Me}-5-\text{i}-\text{C}_3\text{F}_7$
Q34	34-23	3-I	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	3-Me-5-i-C ₂ F ₇

【0100】 第11表 (続き)

Q	No.	Χn	R ¹	R ²			R ³	Ym	mp(℃
Q34	34-24	3-I	H	C(CH	3) ₂ (CH ₂ SOCH ₃	Н	3-Me-5	i-i-c ₃ F ₇
Q34	34-25	3-I	H	C (CH	3) ₂ (СН ₂ SO ₂ СН ₃	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-26	3-I	H	CH (C	H ₃)(CH ₂ NHAc	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-27	3-I	H	C(CH	3) ₂ (CH ₂ NHAc	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-28	3-I	H	CH (C	H ₃)(СН ₂ СН ₂ ОСН ₃	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-29	3-I	H	C(CH	3) ₂ (CH2CH2OCH3			-i-c ₃ F ₇
Q34	34-30	3-I	Et	Et			H	H	144
Q34	34-31	3-I	Et	Et			H	3-Me-5	-c ₂ F ₅
Q34	34-32	3-I	Et	Et			H	3-Me-5	-n-C ₃ F ₇
Q34	34-33	3-I	Et	Et			H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-34	3-I	Et	Et			H	5-C1	- · ·
Q34	34-35	3-I	Et	Et			H	5-Br	
Q34	34-36	3 –I	Et	Et			H	5-n-C ₃	F ₇
Q34	34-37	3-CF	3		H	i-Pr	<u>H</u> _	_3=Me-5	-c ₂ F ₅
Q34	34-38	3-Ph	l		H	i-Pr	H	3-Me-5	-n-c ₃ F ₇
Q34	34-39	3-S0	CF ₃		H	i-Pr	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-40	3-C ₂	F ₅		Ħ	i-Pr	H	3-Me-5	-C ₂ F ₅
Q34	34-41	3-I-	4-C1		H	i-Pr	· H	3-Me-5	-n-C ₃ F ₇
Q34	34-42	3-I-	4-CF	3	H	i-Pr	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-43	3-CF	3-4-	C1	H	i-Pr	H	3-Me-5	-c ₂ F ₅
Q34	34-44	3-0C	F ₂ 0-	4	H	i-Pr	H	3-Me-5	-n-C ₃ F ₇
Q34	34-45	3-0C	F ₂ CF	20-4	H	i-Pr	H	3-Me-5	-i-c ₃ F ₇
Q34	34-46	3-I			Et	Et	Н	5-i-C_	F ₇ 17

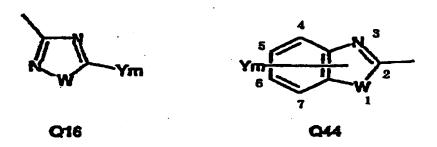


[0101] 第11表(続き)

Q	No.	Хn	R ¹	R^2	R ³	Ym	mp(℃)
Q3	3- 1	3-I	H	i–Pr	H	Н	
Q7	7- 1	3-I	H	i-Pr	H	H	
Q11	11- 1	3-I	H	i-Pr	H	H	
Q14	14- 1	3-I	H	i-Pr	H	H	
Q15	15- 1	3-I	H	i-Pr	H	H	185
Q18	8 18- 1	3-I	H	i–Pr	H	H	
Q20	20- 1	3-I	H	i–Pr	H	H	

[0102]

【化30】



第12表 $(z^1=z^2=0)$

Q	No.	Xn	R ¹	R ²	R ³	W	Ym	物性,Mp(℃)
Q16	16- 1	3-C1	H	i-Pr	H	N-i-Pr	SMe	ペースト状
Q16	16- 2	3-C1	H	i-Pr	H	N-n-Pr	SMe	ペースト状
_Q44	44- 1	H	<u>H</u>	i-Pr	H	S	6-C1	47



[0103]

【実施例】

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

製造例1.

(1-1). N-(4-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-5-イル)-3-ヨードフタル酸イミドの製造。

無水3-3-ドフタル酸0.6gと5-アミノ-4-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール0.44gを酢酸20m1に溶解し、9時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、希塩酸、飽和 $NaHCO_3$ 水及び飽和食塩水で洗浄後、芒硝で乾燥した。溶媒を減圧留去後、得られた残渣をヘキサン/酢酸エチル=3/1の混合溶媒を溶離剤としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより目的物0.71gを得た。

物性: m. p. 105℃ 収率: 69%

[0104]

(1-2). $N^1 - (4-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-5-イル) <math>-N^2 - 4$ イソプロピルー3ーヨードフタル酸ジアミド (化合物No. Q6-8) の製造。

N-(4-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾール-5-イル)-3-コードフタル酸イミド1.06gをジオキサン50m1に溶解し、該溶液にイソプロピルアミン0.4gを加えて室温下3時間撹拌する。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、得られた残渣をヘキサン/酢酸エチル=2/1の混合溶媒を溶離剤としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより目的物0.32gを得た。

物性:m.p.103℃ 収率: 26%

[0105]

製造例 2.....

(2-1). $N^{1} - [2-(1, 1-i) + i) -1, 3, 4-i$

ゾールー4-4ル] $-N^2$, N^2-5 エチルー3-3ードフタル酸ジアミド(化合物No. Q19-34)の製造。

N, Nージエチルー3ーヨードフタル酸ー2ーアミド0.5gと5ーアミノー2ー(1,1ージメチルエチル)ー1,3,4ーチアジアゾール0.27gをテトラヒドロフラン20m1に溶解し、ジエチルホスホリルシアナイド0.28g及びトリエチルアミン0.18gを加え、7時間加熱還流下に反応を行った。反応終了後、反応液に酢酸エチルを加え、希塩酸、飽和NaHCO3水及び飽和食塩水で洗浄後、芒硝で乾燥した。溶媒を減圧留去後、得られた残渣をヘキサン/酢酸エチル=3/1の混合溶媒を溶離剤としたシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより目的物0.11gを得た。

物性:m.p.59℃ 収率: 16%

[0106]

製造例3.

(3-1). $N^1 - (4-メチル-2-ヘプタフルオロイソプロピルピリジン-5-イル) <math>-N^2 - (1-メチル-2-メチルチオエチル) - 3-ヨードフタル酸ジアミド (化合物No. Q27-144) の製造。$

N-(1-メチル-2-メチルチオエチル)-3-ヨードフタル酸イソイミド 0.37g及び5-アミノー4-メチル-2-ヘプタフルオロイソプロピルピリ ジン0.28gをアセトニトリル4m1に溶解し、トリフルオロ酢酸(触媒量) を加え、室温下30分撹拌する。生成した結晶を濾別することにより目的物0. 28gを得た。

物性:m. p. 225℃ 収率: 44%

[0107]

製造例4. 2-アミノ-3-メチル-6-ペンタフルオロエチルピリジン(化合物No. IV-1)の製造。

2-アミノ-5-ヨード-3-メチルピリジン2.34g(0.01モル)、 銅粉2.5g、ヨードペンタフルオロエタン3.7g(0.015モル)をジメ チルスルホキシド20m1に加え、110℃に保ちながら6時間激しく攪拌した 。室温まで冷却した後、反応混合液を氷水500m1中の注ぎ、十分攪拌した後 、不溶物を濾過により除き、酢酸エチル300mlで目的物を抽出した。抽出液を水洗及び無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮後、得られた残渣を酢酸エチル/ヘキサン(3/7)の混合溶媒を溶離剤としたカラムクロマトグラフィーで精製することにより、目的物1.1g(収率20%)を得た。

 1 H-NMR[δ (CDCl $_{3}$)] : 2.17(s.3H), 4.82(br.2H), 7.42(d.1H), 8.16(s.1H). [0 1 0 8]

製造例 5. 3-アミノー2-メトキシー6-(ヘプタフルオロプロパンー2-イル)ピリジン(化合物No. IV-15)の製造。

3-アミノー2-メトキシピリジン3.2g(0.026モル)、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド0.6g、炭酸ナトリウム2.0g、2-ヨードヘプタフルオロプロパン10.0g(0.031モル)をメチルtーブチルエーテル20m1に加え、30℃で攪拌しながら、ハイドロサルファイトナトリウム2.8gを水10m1に溶かした溶液を滴下した。滴下終了後、室温下に20時間反応を続けた後、有機相を分離し、水洗及び無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣を酢酸エチル/ヘキサン(3/7)の混合溶媒を溶離剤としたカラムクロマトグラフィーで精製することにより、目的物2.0g(収率26%)を得た。

¹H-NMR[δ (CDCl₃)] : 3.96(s.3H), 4.03(br.2H), 6.91(d.1H), 7.10(dd.1H). [0 1 0 9]

製造例 6. 3 - アミノー 6 - (1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロイソプロポキシ) ピリジン (化合物No. IV-27) の製造。

水素化ナトリウム2.6gを1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロ-2-プロパノール11.3gのテトラハイドロフラン50m1溶液に少量ずつ5℃以下で加え、同温度で30分間攪拌した後、2-クロロ-5-ニトロピリジン4.7gを加え、室温下に12時間攪拌した。反応液を氷水200m1中に注ぎ、酢酸エチル300m1で抽出した。抽出液を水洗、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮後、得られた残渣を酢酸エチル/ヘキサン(1/10)の混合溶媒を溶離剤としたカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-(1,1,1,3

, 3, 3-ヘキサフルオロイソプロポキシ) - 5-ニトロベンゼン 6. 2 g (収

率:64%)を得た。

得られた2-(1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロイソプロポキシ)-5-ニトロベンゼン4.4g及び電解鉄4.2gを酢酸20m1に加え、60~65℃で30分間攪拌した。反応液を冷却後、6N水酸化ナトリウム水溶液で中和し、不溶物を濾過後、t-ブチルメチルエーテル300m1で抽出した。抽出液を食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮後、得られた残渣を酢酸エチル/ヘキサン(2/3)の混合溶媒を溶離剤としたカラムクロマトグラフィーで精製することにより、3-アミノー6-(1,1,1,3,3,3-ヘキサフルオロイソプロポキシ)ピリジン3.6g(収率:92%)を得た。

[0110]

本発明の一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)、リンゴコシンクイ(Grapholita inopinata)、ナシヒメシンクイ(Grapholita molesta)、マメシンクイガ(Le guminivora glycinivorella)、クワハマキ(Olethreutes mori)チャノホソガ(Caloptilia thevivora)、リンゴホソガ(Caloptilia zachrysa)、キンモンホソガ(Phyllonorycter ringoniella)、ナシホソガ(Spulerrina astaurota)、モンシロチョウ(Piers rapae crucivora)、オオタバコガ類(Heliothis sp.)、コドリンガ(Laspey resia pomonella)、コナガ(Plutella xylostella)、リンゴヒメシンクイ(Argyresthia conjugella)、

[0111]

モモシンクイガ (Carposina niponensis) 、二カメイガ (Chilo suppressalis) 、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis) 、チャマダラメイガ (Ephestia e lutella) 、クワノメイガ (Glyphodes pyloalis) 、サンカメイガ (Scirpophag a incertulas) 、イチモンジセセリ (Parnara guttata) 、アワヨトウ (Pseuda letia separata) 、イネヨトウ (Sesamia inferens) 、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura) 、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua) 等の鱗翅目害虫、

フタテンヨコバイ (Macrosteles fascifr ns)、ツマグロヨコバイ (Nephotetti x cincticeps)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、セジロウンカ (S ga tella furcifera)、ミカンキジラミ (Diaphorina citri)、ブドウコナジラミ (Aleurolobus taonabae)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、ニセダイコンナブラムシ (Lipaphis erysimi)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)、ツノロウムシ (Ceroplas tes ceriferus)、ミカンワタカイガラムシ (Pulvinaria aurantii)、ミカンマルカイガラムシ (Pseudaonidia duplex)、

[0112]

ナシマルカイガラムシ(Comstockaspis perniciosa)、ヤノネカイガラムシ(Un aspis yanonensis)等の半翅目害虫、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popillia japonica)、タバコシバンムシ(Lasioderma serricorne)、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、ニジュウヤホシテントウ(Epilachma vigintiotopunctata)、アズキゾウムシ(Callosobruchus chinensis)、ヤサイゾウムシ(Listroderes costirostris)、コクゾウムシ(Sitophilus zeamais)、ワタミゾウムシ(Anthonomus gradis gradis)、イネミズゾウムシ(Lissor h ptrus oryzophilus)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、イネドロオイムシ(Oulema oryzae)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)、コロラドポテトビートル(Leptinotar sa decemlineata)、メキシカンビーンビートル(Epilachna varivestis)、コーンルートワーム類(Diabrotica sp.)等の甲虫目害虫、ウリミバエ(Dacus(Zeugodacus) cucurbitae)、ミカンコミバエ(Dacus(Bactrocera) dorsalis)、

[0113]

イネハモグリバエ (Agromyza oryzae)、タマネギバエ (Delia antiqua)、タネバエ (Delia platura)、ダイズサヤタマバエ (Asphondylia sp.)、イエバエ (Musca domestica)、アカイエカ (Culex pipiens pipiens)等の双翅目害虫、ネグサレセンチュウ (Pratylenchus sp.)、ミナミネグサレセンチュウ (Pratylenchus coffeae)、ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis)、ネコブセンチュウ (Meloidogyne sp.)、ミカンネセンチュウ (Tylenchu

lus semipenetrans)、ニセネグサレセンチュウ (Aphelenchus avenae)、ハガレセンチュウ (Aphelench ides ritzemabosi) 等のハリセンチュウ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

[0114]

本発明の一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体を有効成分とする農園 芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

[0115]

本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体はこれらを適当な不活性 担体に又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁 、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤 、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライド等)、シリカ類(例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕)、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。



[0116]

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒 能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなるも のから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは 単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例 えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコ ール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチル ケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えばエチ ルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラ ン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例 えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素 、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソプピルフタレー ト、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチ ルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル 類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができ る。

[0117]

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性 剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレ ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオ キシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、 ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩 、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エ ステル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に

例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

[0118]

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸 塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或いは粒剤とする場合は0.01~50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01~50重量%が適当である。

[0119]

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま又は水等で適宜 希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除にに有効な量を当該害虫の発生が予測 される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.1g~10kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用病虫害防除剤と混合して使用することも可能である。

[0120]

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

第2表乃至第12表記載の化合物

50部

キシレン

40部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物

10部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

製剤例2.

第2表乃至第12表記載の化合物

3 部

クレー粉末

8 2 部

珪藻土粉末

15部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

[0121]

製剤例3.

第2表乃至第12表記載の化合物

5部

ベントナイトとクレーの混合粉末

90部

リグニンスルホン酸カルシウム

5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする

製剤例4.

第2表乃至第12表記載の化合物

20部

カオリンと合成高分散珪酸

75部

ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアル

キルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物

5部

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

[0122]

試験例1. コナガ (Plutella xylostella) に対する殺虫試験。

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第2表乃至第12表記載の化合物を有効成分とする薬剤を10 00ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の25℃の恒温 室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算 出し、下記基準に従って判定を行った。 1 区 1 0 頭 3 連制 [数 1]

無処理区孵化虫数一処理区孵化虫数

補正死虫率 (%) =----×100

無処理区孵化虫数

判定基準。 A···死虫率100%

B···死虫率99%~90%

C···死虫率89%~80%

D···死虫率79%~50%

[0123]

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は、Q1-12、Q1-41、 Q1-42, Q4-6, Q4-8, Q4-12, Q4-45, Q6-6, Q6-68, Q8-1, Q8-2, Q8-3, Q8-5, Q8-11, Q8-13, Q8-14, Q8-15, Q8-53, Q9-15, Q10-7, Q15-1, Q26-1, Q26-11, Q26-29, Q26-30, Q26-31, Q26-32, Q26-33, Q26-43, Q27-29, Q27-30, Q27-31, Q27-32, Q27-81, Q27-98, Q27-124, Q27-1 25, Q27-126, Q27-127, Q27-128, Q27-129, Q 27-130, Q27-131, Q27-132, Q27-133, Q27-1 34, Q27-135, Q27-136, Q27-137, Q27-138, Q 27-139, Q27-140, Q27-141, Q27-142, Q27-1 43, Q27-144, Q27-145, Q27-150, Q27-151, Q 27-153, Q27-164, Q27-230, Q27-231, Q27-2 32, Q27-233, Q27-234, Q27-235, Q27-236, Q 27-238, Q27-239, Q27-240, Q27-241, Q27-2 4 2、Q 2 7 - 2 4 3、Q 2 7 - 2 4 4、Q 2 7 - 2 4 5、Q 2 7 - 2 4 6、Q 27-247, $Q27-248\sim Q27-263$, Q32-11, Q32-19

出証特2000-3053716

,Q33-1、Q33-10、Q34-30、Q34-46及びQ43-1であ



った。

[0124]

試験例2. ハスモンヨトウ (Spodoptera litura) に対する殺虫試験。

第2表乃至第12表記載の化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液にキャベツ薬片(品種:四季穫)を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制「数2]

無処理区生存虫数一処理区生存虫数

補正死虫率(%)=-

-x100

無処理区生存虫数

[0125]

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は、Q26-1、Q26-11、Q26-29、Q26-30、Q26-31、Q26-32、Q26-33、Q26-43、Q27-29、Q27-30、Q27-31、Q27-32、Q27-81、Q27-98、Q27-124、Q27-125、Q27-126、Q27-127、Q27-128、Q27-129、Q27-130、Q27-131、Q27-132、Q27-133、Q27-134、Q27-135、Q27-136、Q27-137、Q27-138、Q27-139、Q27-136、Q27-136、Q27-137、Q27-138、Q27-139、Q27-140、Q27-141、Q27-142、Q27-143、Q27-144、Q27-145、Q27-150、Q27-151、Q27-153、Q27-164、Q27-230、Q27-231、Q27-232、Q27-233、Q27-234、Q27-231、Q27-232、Q27-233、Q27-234、Q27-241、Q27-242、Q27-243、Q27-244、Q27-245、Q27-246、Q27-247、Q27-248~Q27-263、Q32-19及びQ34-46であった。

[0126]

試験例3.コブノメイガ(Cnaphalocrocis medinalis)に対する殺虫試験。

第2表乃至第12表記載の化合物を有効成分とする薬剤を500ppmに希釈した薬液に稲葉身部(6~8葉期)を約30秒間浸漬し、風乾後に湿潤濾紙を敷いた直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、コブノメイガ3令幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温室に静置した。接種4日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は、Q26-1、Q26-29、Q26-30、Q26-31、Q26-32、Q26-33、Q27-29、Q27-30、Q27-31、Q27-32、Q27-81、Q27-98、Q27-124、Q27-125、Q27-126、Q27-127、Q27-128、Q27-129、Q27-130、Q27-131、Q27-132、Q27-133、Q27-134、Q27-135、Q27-136、Q27-137、Q27-138、Q27-139、Q27-140、Q27-141、Q27-142、Q27-143、Q27-144、Q27-145及びQ27-164であった。

1

【書類名】 要約書

【要約】

【解決手段】 一般式(I):

【化1】

$$Xn = \begin{bmatrix} Z^1 \\ N(R^1)R^2 \\ N(R^3)Q \end{bmatrix}$$
 (I)

 ${\{}$ 式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 はH、(ハロ) C_3 - C_6 シクロアルキル、 $-A^1$ -(G)r(式中、 A^1 は C_1 - C_8 アルキレン、 C_3 - C_6 アルケニレン等、GはH、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロ C_1 - C_6 アルキル、(置換フェニル)、(置換)複素環等、rは $1\sim 4$)、Qは置換されても良いO、S、Nを含む(縮合)複素環、XはH、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロ C_1 - C_6 アルキル、(置換)フェニル、(置換)複素環等、nは $1\sim 4$ 、 Z^1 、 Z^2 はO:S)で表されるフタル酸ジアミド誘導体、その中間体である一般式(IV):

$$Q'-NH_2$$
 (IV')

(式中、Q'はQの内の特定の(縮合)複素環)で表される複素環アミン誘導体 及び農園芸用薬剤並びにその使用方法。

【効果】 水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫等の防除に顕著な効果を示す。

【選択図】 なし



出願人履歴情報

識別番号

[000232623]

1. 変更年月日

1990年 8月 9日

[変更理由]

新規登録

住 所

東京都中央区日本橋1丁目2番5号

氏 名

日本農薬株式会社

THIS PAGE BLANK (USPTO)